

参考例 2 で製造した樹脂（3）（0.5 g）、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン（0.396 g）、チオフェン-2-イルメチルアミン（0.205 m l）および N-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシン（0.542 g）、4-フェニルオキシベンゾアルデヒド（0.252 g）を用いて、実施例 2 3 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物（274 mg）を得た。

TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (m, 2 H), 7.39 (m, 2 H), 7.28 (m, 1 H), 7.18 (m, 2 H),
7.04 (m, 4 H), 6.91 (m, 1 H), 4.86 (s, 2 H), 4.32 (s, 2 H), 4.12 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz,
1 H), 3.77 (m, 2 H), 3.49 (m, 2 H), 2.60 - 2.30 (m, 2 H), 2.19 (m, 2 H), 1.98 (s, 3
H), 1.97 - 1.58 (m, 3 H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 6 H)。

実施例 2 3 (H 2 2 - 1) ~ 2 3 (H 3 1 - 3 1)

参考例 2 で製造した樹脂（3）、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当するアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体、および相当するアルデヒド誘導体を用いて、実施例 2 3 または 2 3 (1) と同様の操作をし、以下の表 2 2 A-1 ~ 3 1 A-4 に化合物名を示し、表 2 2 B-1 ~ 3 1 B-5 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 2 2 C-1 ~ 3 1 C-2 に示した。

表 22A-1

実施例番号	化合物名
23 (H22-1)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-2)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-3)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-メチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-4)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-5)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(1-(ベンジルオキシメチル)イミダゾール-5-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-6)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-7)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-8)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-(ベンジルオキシ)エチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 22A-2

実施例番号	化合物名
23 (H22-9)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ピリジン-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-10)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ブチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-11)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルオキシカルボニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-12)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-13)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルオキシカルボニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-14)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-(シクロヘキシルオキシカルボニル)エチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-15)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシ)フェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-16)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 22A-3

実施例番号	化合物名
23 (H22-17)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシ)フェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-18)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ブチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-19)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-20)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-((1S)-1-(ベンジルオキシ)エチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-21)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-22)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-((4-メトキシフェニルメチルチオ)メチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-23)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルチオメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-24)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 22A-4

実施例番号	化合物名
23 (H22-25)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(イミダゾール-4-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-26)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-27)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-((3-ニトロピリジン-2-イル)ジスルファニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-28)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ベンジルイミダゾール-4-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-29)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-30)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)フェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-31)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(アミノカルボニルアミノ)プロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-32)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ナフチルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 22A-5

実施例番号	化合物名
23 (H22-33)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (3, 4-ジクロロフェニルメチル) - 9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-34)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- ((1, 1-ジメチルエチルチオ) メチル) - 9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-35)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 4-メチル-9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-36)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-プロピル-9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-37)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4-ベンジルオキシフェニルメチル) - 4-メチル-9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-38)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- ((1R)-1-ヒドロキシエチル) - 9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-39)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (アミノカルボニルメチル) - 9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-40)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- ((1R)-1-ヒドロキシエチル) - 9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-41)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-メチル-9- (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-6

実施例番号	化合物名
23 (H22-42)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(ピリジン-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-43)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(カルボキシメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-44)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-45)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(2-メチルチオエチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-46)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-((メチルカルボニルアミノ)メチルチオメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-47)	(3R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-((1S)-1-ヒドロキシエチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-48)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(2-クロロフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-49)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(1-ナフチルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-50)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキゾ-3-(4-フルオロフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 22A-7

実施例番号	化合物名
23 (H22-51)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シアノメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-52)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-53)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(2-クロロフェニルメチルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-54)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシカルボニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-55)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(1-イミノ-1-(2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ)メチルアミノ)プロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-56)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシカルボニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-57)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H22-58)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 22A-8

実施例番号	化合物名
23 (H22-59)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-60)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-61)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(1-(ベンジルオキシメチル) イミダゾール-4-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-62)	(3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-エトキシフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-63)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-フェニルフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H22-64)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(1, 1-ジフェニルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 23A-1

実施例番号	化合物名
23 (H23-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ジベンゾフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 23A-2

実施例番号	化合物名
23 (H23-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ジベンゾフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H23-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 24A-1

実施例番号	化合物名
23 (H24-1)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-2)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-3)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-4)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-5)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-6)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-7)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-8)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-9)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 24A-2

実施例番号	化合物名
23 (H24-10)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-11)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-12)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-13)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-14)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-15)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-16)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-17)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-18)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 24A-3

実施例番号	化合物名
23 (H24-19)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-20)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-21)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-22)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-23)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-24)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-25)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 24A-4

実施例番号	化合物名
23 (H24-26)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-27)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-28)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-29)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-30)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-31)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 25A-1

実施例番号	化合物名
23 (H25-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 25A-2

実施例番号	化合物名
23 (H25-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 25A-3

実施例番号	化合物名
23 (H25-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 25A-4

実施例番号	化合物名
23 (H25-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 26A-1

実施例番号	化合物名
23 (H26-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 26A-2

実施例番号	化合物名
23 (H26-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 26A-3

実施例番号	化合物名
23 (H26-19)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-20)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-21)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-22)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-23)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-25)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 26A-4

実施例番号	化合物名
23 (H26-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-27)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-29)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-30)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 27A-1

実施例番号	化合物名
23 (H27-1)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-2)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-3)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-4)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェノキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-5)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ベンジルオキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-6)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-7)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-8)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ヒドロキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H27-9)	1-((2-メトキシフェニル)メチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 27A-2

実施例番号	化合物名
23 (H27-10)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-11)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-12)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-13)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-14)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-15)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-16)	1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-3

実施例番号	化合物名
23 (H27-17)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-18)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-19)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-20)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-21)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-22)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-23)	1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) -2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) -9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-4

実施例番号	化合物名
23 (H27-24)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9-ベンジル - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-25)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-26)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-27)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-28)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル - 1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-29)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-30)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-5

実施例番号	化合物名
23 (H27-31)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-32)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-33)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2H,3H-ベンゾ[3,4-e]1,4-ジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-34)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェノキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-35)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ベンジルオキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-36)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-37)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 27A-6

実施例番号	化合物名
23 (H27-38)	1-(ピリジン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ヒドロキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-39)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-40)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-41)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-42)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェノキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-43)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ベンジルオキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-44)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 27A-7

実施例番号	化合物名
23 (H27-45)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-46)	1-(ピリジン-3-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ヒドロキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-47)	1-(ピリジン-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-48)	1-(ピリジン-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-49)	1-(ピリジン-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-50)	1-(ピリジン-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェノキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H27-51)	1-(ピリジン-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ベンジルオキシフェニル)メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 27A-8

実施例番号	化合物名
23 (H27-52)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル-1 - フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-53)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-54)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-55)	1 - ((2 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ベンジル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-56)	1 - ((2 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-57)	1 - ((2 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-58)	1 - ((2 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-9

実施例番号	化合物名
23 (H27-59)	1 - ((2-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-60)	1 - ((2-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-61)	1 - ((2-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-62)	1 - ((2-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-63)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-64)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-65)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-10

実施例番号	化合物名
23 (H27-66)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-67)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-68)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-69)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-70)	1 - ((3-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-71)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-72)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-11

実施例番号	化合物名
23 (H27-73)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-74)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-75)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-76)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-77)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-78)	1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 28A-1

実施例番号	化合物名
23 (H28-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 28A-2

実施例番号	化合物名
23 (H28-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 28A-3

実施例番号	化合物名
23 (H28-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H28-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 28A-4

実施例番号	化合物名
23 (H28-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-29)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-30)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 29A-1

実施例番号	化合物名
23 (H29-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 29A-2

実施例番号	化合物名
23 (H29-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 29A-3

実施例番号	化合物名
23 (H29-19)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-20)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-21)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-22)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-23)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-25)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 29A-4

実施例番号	化合物名
23 (H29-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-27)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-29)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-30)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 30A-1

実施例番号	化合物名
23 (H30-1)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-2)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-3)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-4)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-5)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-6)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-7)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-8)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-2

実施例番号	化合物名
23 (H30-9)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-10)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2,4-ジオキソ-1,3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-11)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-12)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-13)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-14)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-15)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-3

実施例番号	化合物名
23 (H30-16)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-17)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-18)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-19)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-20)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-21)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-22)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-4

実施例番号	化合物名
23 (H30-23)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-24)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-25)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-26)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-27)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-28)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-29)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-5

実施例番号	化合物名
23 (H30-30)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2,5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-31)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.6]ウンデカン

表 31A-1

実施例番号	化合物名
23 (H31-1)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-2)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-3)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-4)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-5)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-6)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-7)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-8)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-9)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 31A-2

実施例番号	化合物名
23 (H31-10)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-11)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-12)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-13)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-14)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-15)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-16)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-17)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-18)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

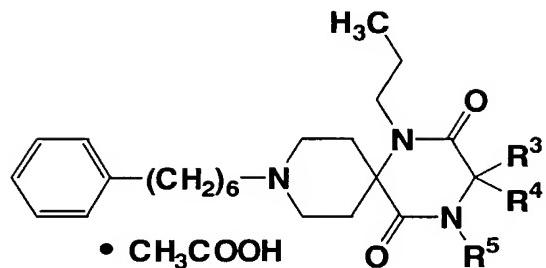
表 31A-3

実施例番号	化合物名
23 (H31-19)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-20)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-21)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-22)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-23)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-24)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H31-25)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 31A-4

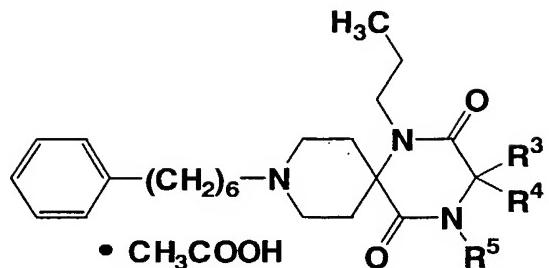
実施例番号	化合物名
23 (H31-26)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-27)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-28)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-29)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-30)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-31)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 22B-1



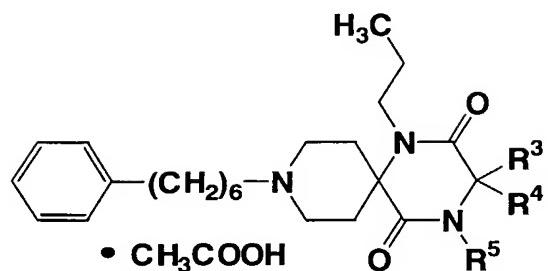
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-1)	H		H
23 (H22-2)	H		H
23 (H22-3)	H		H
23 (H22-4)	H		H
23 (H22-5)	H		H
23 (H22-6)	H		H
23 (H22-7)	H		H
23 (H22-8)	H		H

表 22B-2



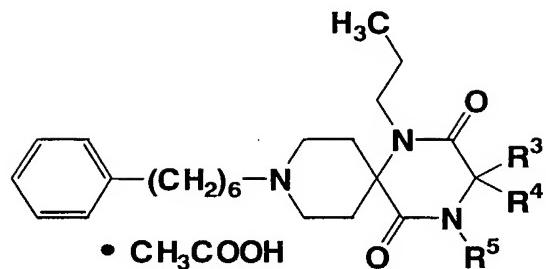
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-9)	H		H
23 (H22-10)	H		H
23 (H22-11)	H		H
23 (H22-12)	H		H
23 (H22-13)	H		H
23 (H22-14)	H		H
23 (H22-15)	H		H
23 (H22-16)	H		H

表 22B-3



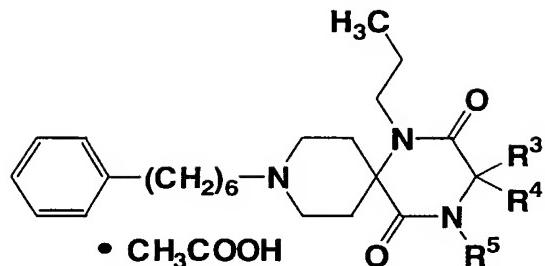
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-17)	H		H
23 (H22-18)	H		H
23 (H22-19)	H		H
23 (H22-20)	H		H
23 (H22-21)	H		H
23 (H22-22)	H		H
23 (H22-23)	H		H
23 (H22-24)	H		H

表 22B-4



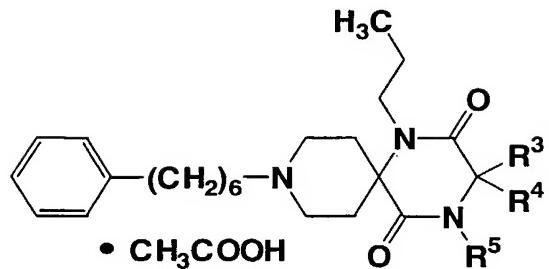
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-25)	H		H
23 (H22-26)	H		H
23 (H22-27)	H		H
23 (H22-28)	H		H
23 (H22-29)	H		H
23 (H22-30)	H		H
23 (H22-31)	H		H

表 22B-5



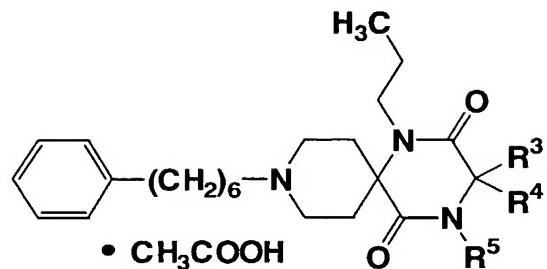
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-32)	H		H
23 (H22-33)	H		H
23 (H22-34)	H		H
23 (H22-35)	H		X ₅ -CH ₃
23 (H22-36)	H		H
23 (H22-37)	H		X ₅ -CH ₃
23 (H22-38)	H		H
23 (H22-39)	H		H

表 22B-6



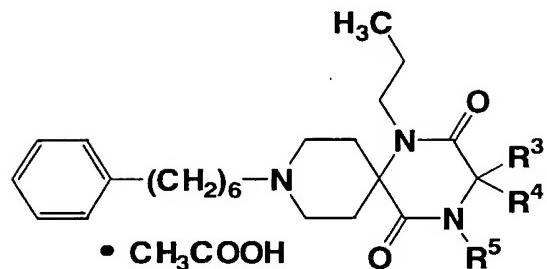
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-40)	H	X ₄ ···CH(OH)CH ₃	H
23 (H22-41)	H	X ₄ —CH ₃	H
23 (H22-42)	H	X ₄ —CH ₂ pyridine	H
23 (H22-43)	H	X ₄ ···CH(OH)C(=O)O	H
23 (H22-44)	H	X ₄ ···C ₆ H ₄ OH	H
23 (H22-45)	H	X ₄ ···CH ₂ SCH ₃	H
23 (H22-46)	H	X ₄ ···CH ₂ CH ₂ NHCH ₃ C(=O)O	H
23 (H22-47)	H	X ₄ ···CH(OH)CH ₃	H
23 (H22-48)	H	X ₄ ···C ₆ H ₄ Cl	H

表 22B-7



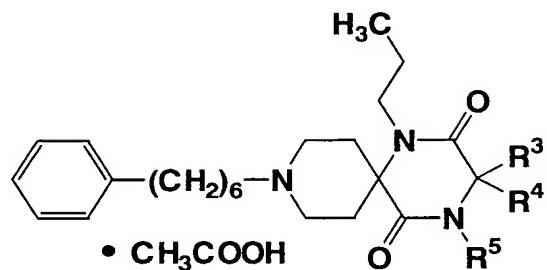
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-49)	H		H
23 (H22-50)	H		H
23 (H22-51)	H		H
23 (H22-52)	H		H
23 (H22-53)	H		H
23 (H22-54)	H		H
23 (H22-55)	H		H

表 22B-8



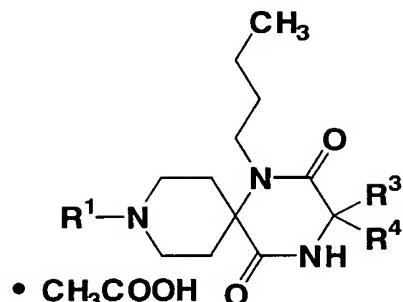
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-56)	H		H
23 (H22-57)	H		H
23 (H22-58)	H		H
23 (H22-59)	H		H
23 (H22-60)	H		H
23 (H22-61)	H		H

表 22B-9



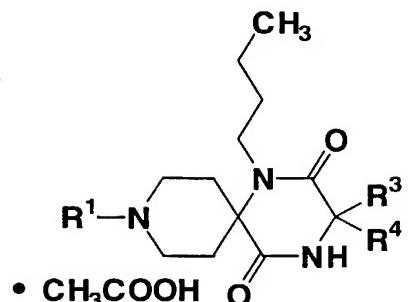
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-62)	H		H
23 (H22-63)	H		H
23 (H22-64)	H		H

表 23B-1



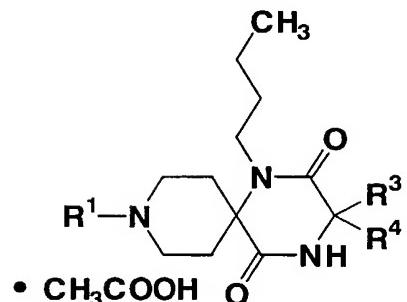
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-1)		H	
23 (H23-2)		H	
23 (H23-3)		H	
23 (H23-4)		H	
23 (H23-5)		H	
23 (H23-6)		H	
23 (H23-7)		H	
23 (H23-8)		H	

表 23B-2



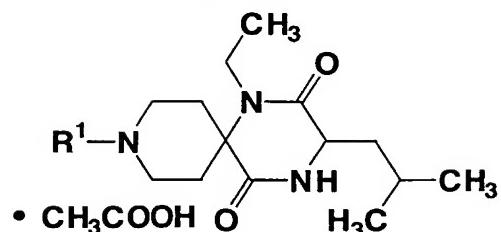
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-9)		H	
23 (H23-10)		H	
23 (H23-11)		H	
23 (H23-12)		H	
23 (H23-13)		H	
23 (H23-14)		H	
23 (H23-15)		H	

表 23B-3



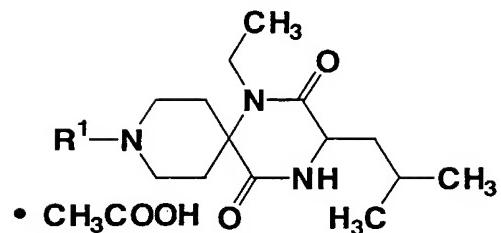
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-16)		H	
23 (H23-17)		H	
23 (H23-18)		H	

表 24B-1



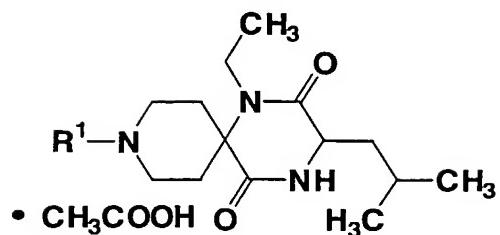
実施例番号	R¹
23 (H24-1)	
23 (H24-2)	
23 (H24-3)	
23 (H24-4)	
23 (H24-5)	
23 (H24-6)	
23 (H24-7)	
23 (H24-8)	

表 24B-2



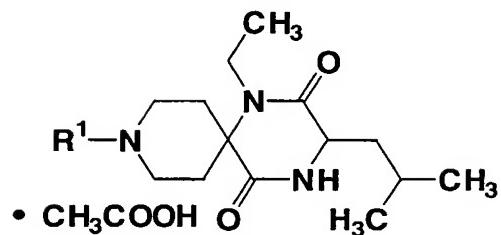
実施例番号	R^1
23 (H24-9)	
23 (H24-10)	
23 (H24-11)	
23 (H24-12)	
23 (H24-13)	
23 (H24-14)	
23 (H24-15)	
23 (H24-16)	

表 24B-3



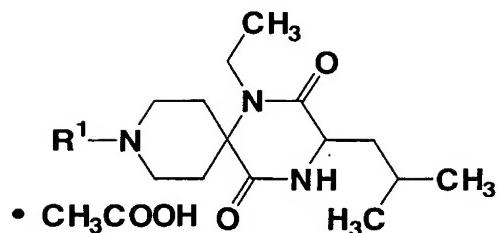
実施例番号	R¹
23 (H24-17)	
23 (H24-18)	
23 (H24-19)	
23 (H24-20)	
23 (H24-21)	
23 (H24-22)	

表 24B-4



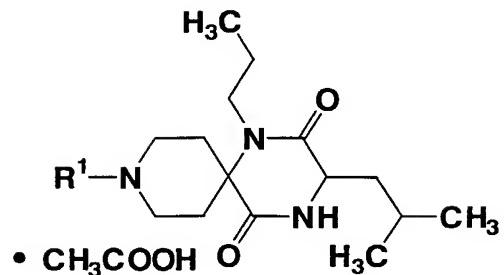
実施例番号	R¹
23 (H24-23)	
23 (H24-24)	
23 (H24-25)	
23 (H24-26)	
23 (H24-27)	
23 (H24-28)	

表 24B-5



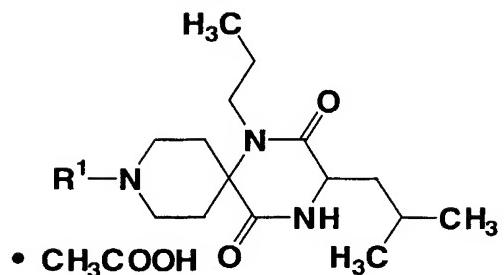
実施例番号	R ¹
23 (H24-29)	
23 (H24-30)	
23 (H24-31)	

表 25B-1



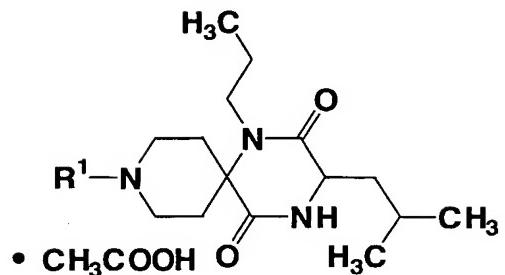
実施例番号	R ¹
23 (H25-1)	
23 (H25-2)	
23 (H25-3)	
23 (H25-4)	
23 (H25-5)	
23 (H25-6)	
23 (H25-7)	
23 (H25-8)	

表 25B-2



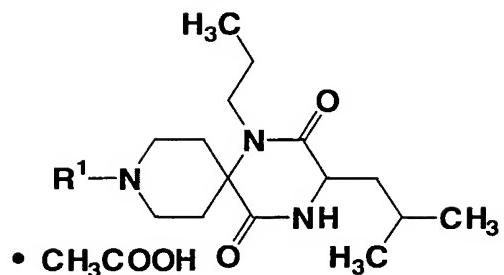
実施例番号	R^1
23 (H25-9)	
23 (H25-10)	
23 (H25-11)	
23 (H25-12)	
23 (H25-13)	
23 (H25-14)	
23 (H25-15)	

表 25B-3



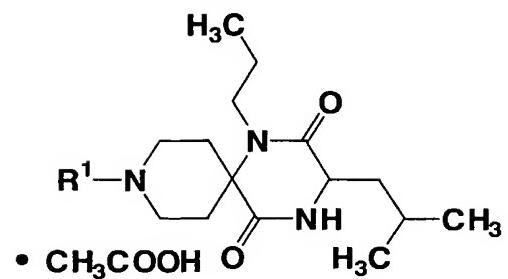
実施例番号	R¹
23 (H25-16)	
23 (H25-17)	
23 (H25-18)	
23 (H25-19)	
23 (H25-20)	
23 (H25-21)	

表 25B-4



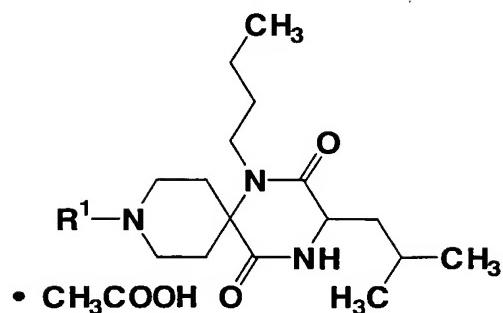
実施例番号	R¹
23 (H25-22)	
23 (H25-23)	
23 (H25-24)	
23 (H25-25)	
23 (H25-26)	
23 (H25-27)	

表 25B-5



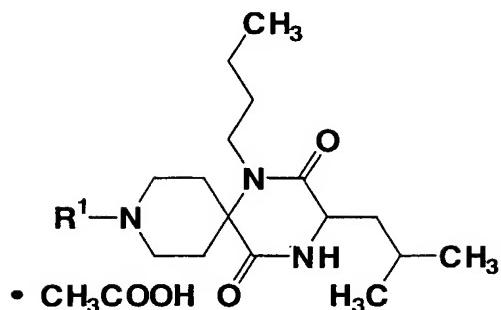
実施例番号	R ¹
23 (H25-28)	

表 26B-1



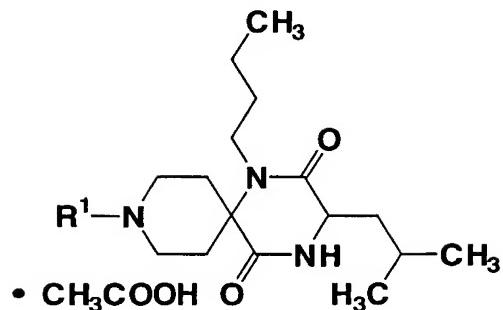
実施例番号	R ¹
23 (H26-1)	
23 (H26-2)	
23 (H26-3)	
23 (H26-4)	
23 (H26-5)	
23 (H26-6)	
23 (H26-7)	
23 (H26-8)	

表 26B-2



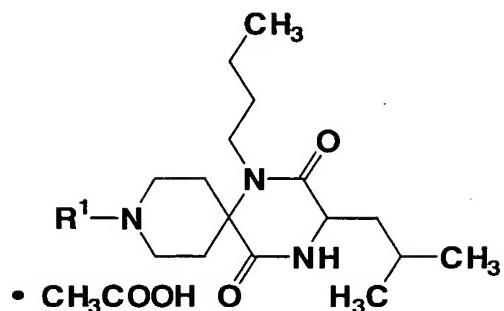
実施例番号	R^1
23 (H26-9)	
23 (H26-10)	
23 (H26-11)	
23 (H26-12)	
23 (H26-13)	
23 (H26-14)	
23 (H26-15)	

表 26B-3



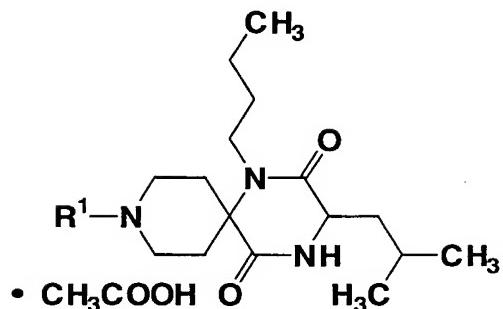
実施例番号	R ¹
23 (H26-16)	
23 (H26-17)	
23 (H26-18)	
23 (H26-19)	
23 (H26-20)	
23 (H26-21)	
23 (H26-22)	

表 26B-4



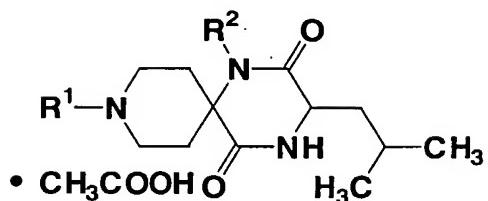
実施例番号	R ¹
23 (H26-23)	
23 (H26-24)	
23 (H26-25)	
23 (H26-26)	
23 (H26-27)	

表 26B-5



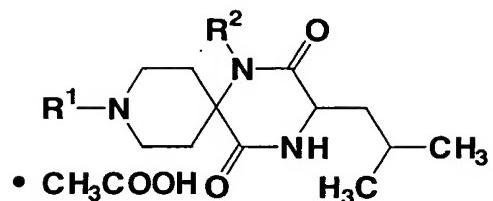
実施例番号	R ¹
23 (H26-28)	
23 (H26-29)	
23 (H26-30)	
23 (H26-31)	

表 27B-1



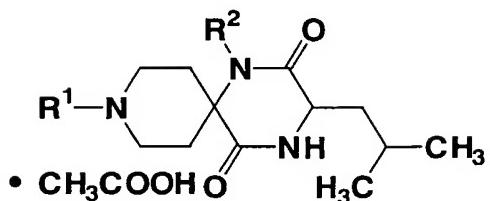
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-1)		
23 (H27-2)		
23 (H27-3)		
23 (H27-4)		
23 (H27-5)		
23 (H27-6)		
23 (H27-7)		
23 (H27-8)		

表 27B-2



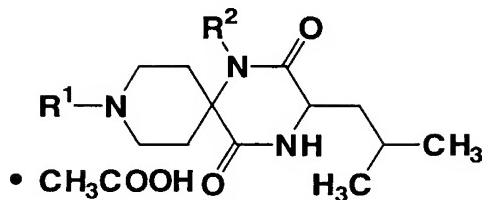
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-9)		
23 (H27-10)		
23 (H27-11)		
23 (H27-12)		
23 (H27-13)		
23 (H27-14)		

表 27B-3



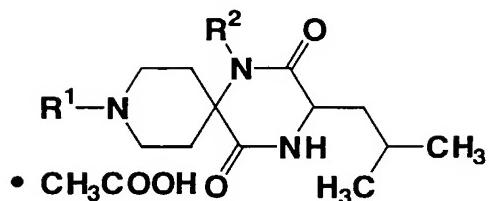
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-15)		
23 (H27-16)		
23 (H27-17)		
23 (H27-18)		
23 (H27-19)		
23 (H27-20)		
23 (H27-21)		

表 27B-4



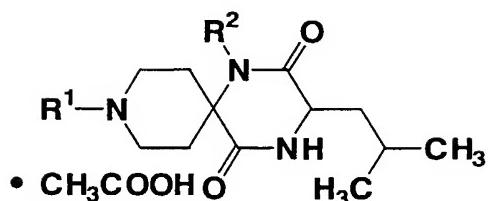
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-22)		
23 (H27-23)		
23 (H27-24)		
23 (H27-25)		
23 (H27-26)		
23 (H27-27)		
23 (H27-28)		
23 (H27-29)		

表 27B-5



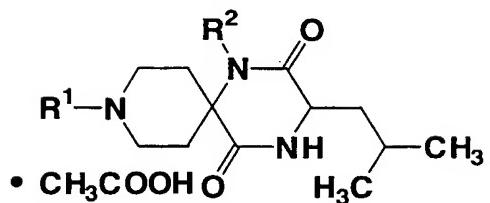
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-30)		
23 (H27-31)		
23 (H27-32)		
23 (H27-33)		
23 (H27-34)		
23 (H27-35)		
23 (H27-36)		
23 (H27-37)		

表 27B-6



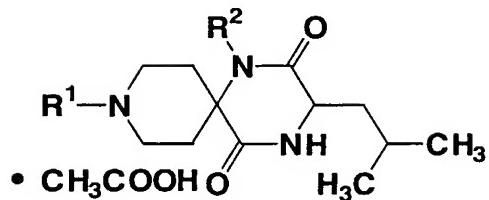
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-38)		
23 (H27-39)		
23 (H27-40)		
23 (H27-41)		
23 (H27-42)		
23 (H27-43)		
23 (H27-44)		
23 (H27-45)		

表 27B-7



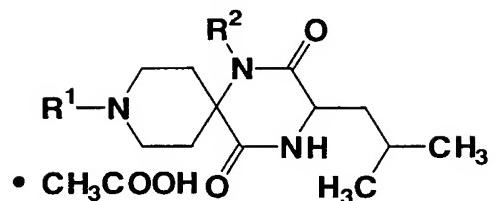
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-46)		
23 (H27-47)		
23 (H27-48)		
23 (H27-49)		
23 (H27-50)		
23 (H27-51)		
23 (H27-52)		
23 (H27-53)		

表 27B-8



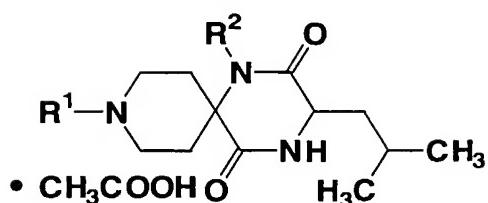
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-54)		
23 (H27-55)		
23 (H27-56)		
23 (H27-57)		
23 (H27-58)		
23 (H27-59)		
23 (H27-60)		

表 27B-9



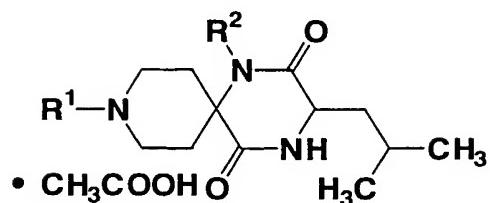
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-61)		
23 (H27-62)		
23 (H27-63)		
23 (H27-64)		
23 (H27-65)		
23 (H27-66)		
23 (H27-67)		

表 27B-10



実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-68)		
23 (H27-69)		
23 (H27-70)		
23 (H27-71)		
23 (H27-72)		
23 (H27-73)		
23 (H27-74)		
23 (H27-75)		

表 27B-11



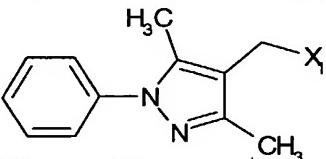
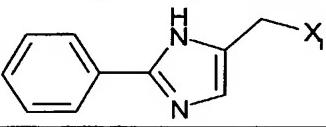
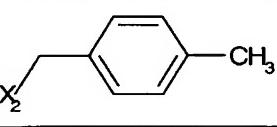
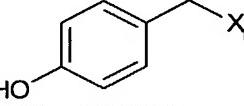
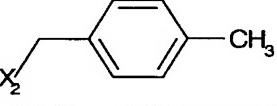
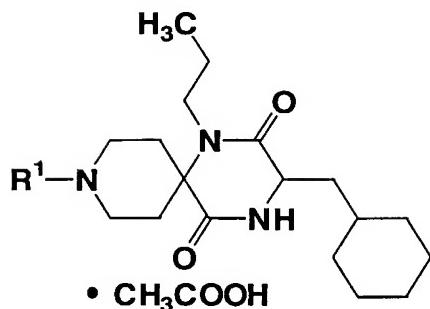
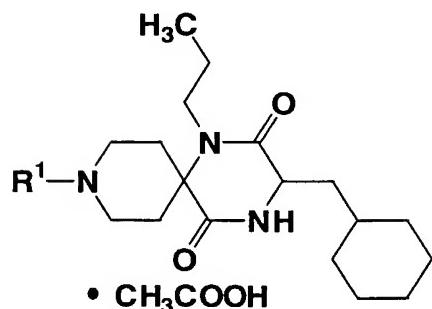
実施例番号	R^1	R^2
23 (H27-76)		
23 (H27-77)		
23 (H27-78)		

表 28B-1



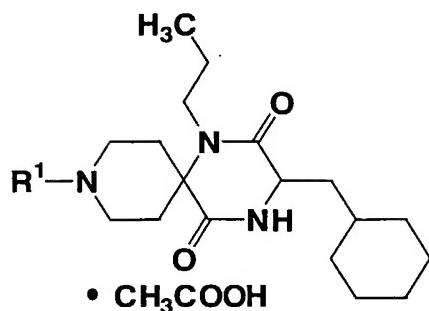
実施例番号	R ¹
23 (H28-1)	
23 (H28-2)	
23 (H28-3)	
23 (H28-4)	
23 (H28-5)	
23 (H28-6)	
23 (H28-7)	
23 (H28-8)	

表 28B-2



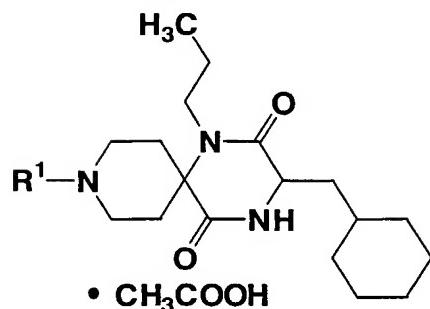
実施例番号	R^1
23 (H28-9)	
23 (H28-10)	
23 (H28-11)	
23 (H28-12)	
23 (H28-13)	
23 (H28-14)	
23 (H28-15)	
23 (H28-16)	

表 28B-3



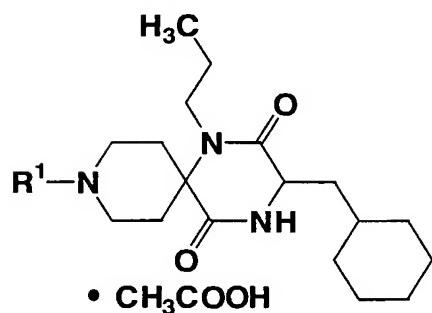
実施例番号	R ¹
23 (H28-17)	
23 (H28-18)	
23 (H28-19)	
23 (H28-20)	
23 (H28-21)	
23 (H28-22)	

表 28B-4



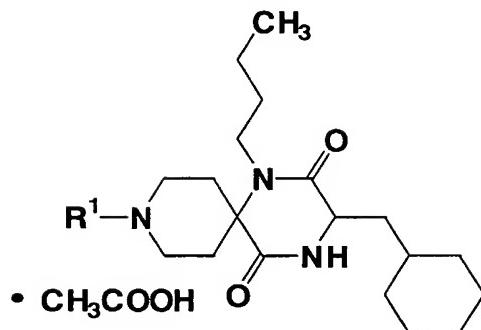
実施例番号	R^1
23 (H28-23)	
23 (H28-24)	
23 (H28-25)	
23 (H28-26)	
23 (H28-27)	
23 (H28-28)	

表 28B-5



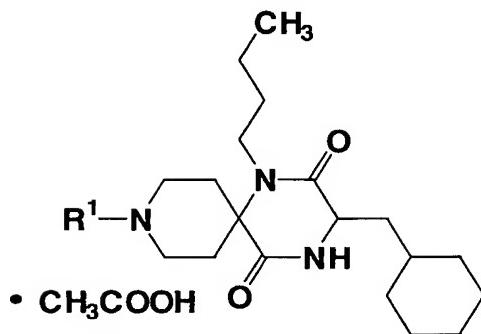
実施例番号	R^1
23 (H28-29)	
23 (H28-30)	

表 29B-1



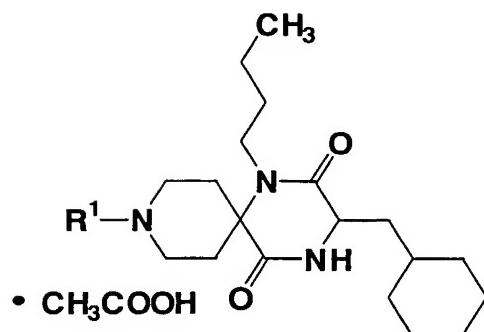
実施例番号	R^1
23 (H29-1)	
23 (H29-2)	
23 (H29-3)	
23 (H29-4)	
23 (H29-5)	
23 (H29-6)	
23 (H29-7)	

表 29B-2



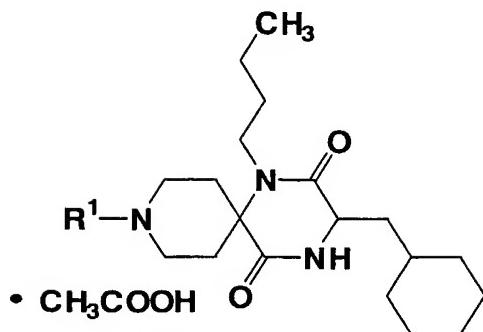
実施例番号	R¹
23 (H29-8)	
23 (H29-9)	
23 (H29-10)	
23 (H29-11)	
23 (H29-12)	
23 (H29-13)	
23 (H29-14)	

表 29B-3



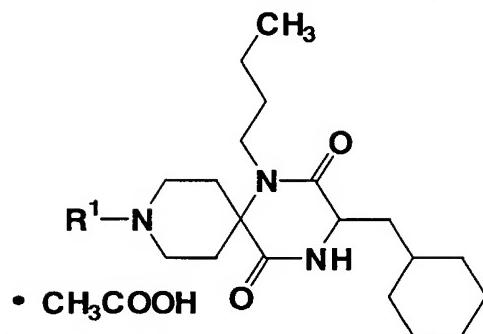
実施例番号	R^1
23 (H29-15)	
23 (H29-16)	
23 (H29-17)	
23 (H29-18)	
23 (H29-19)	
23 (H29-20)	
23 (H29-21)	

表 29B-4



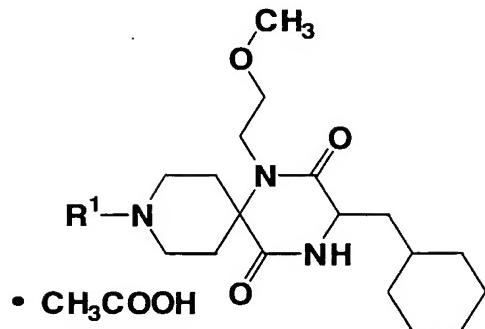
実施例番号	R¹
23 (H29-22)	
23 (H29-23)	
23 (H29-24)	
23 (H29-25)	
23 (H29-26)	

表 29B-5



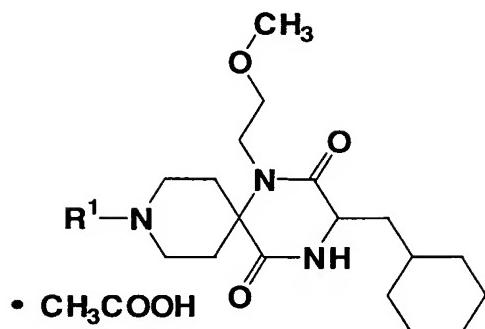
実施例番号	R¹
23 (H29-27)	
23 (H29-28)	
23 (H29-29)	
23 (H29-30)	
23 (H29-31)	

表 30B-1



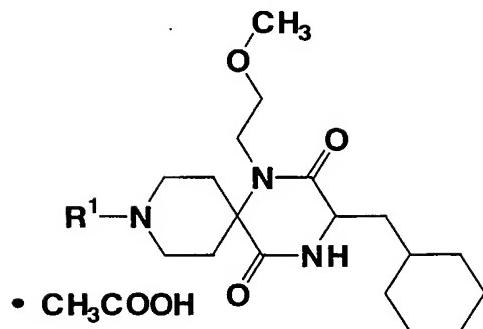
実施例番号	R¹
23 (H30-1)	
23 (H30-2)	
23 (H30-3)	
23 (H30-4)	
23 (H30-5)	
23 (H30-6)	
23 (H30-7)	

表 30B-2



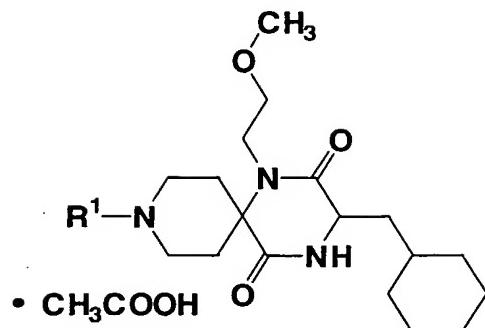
実施例番号	R^1
23 (H30-8)	
23 (H30-9)	
23 (H30-10)	
23 (H30-11)	
23 (H30-12)	
23 (H30-13)	
23 (H30-14)	

表 30B-3



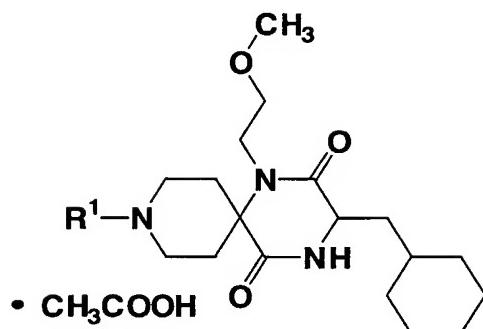
実施例番号	R¹
23 (H30-15)	
23 (H30-16)	
23 (H30-17)	
23 (H30-18)	
23 (H30-19)	
23 (H30-20)	

表 30B-4



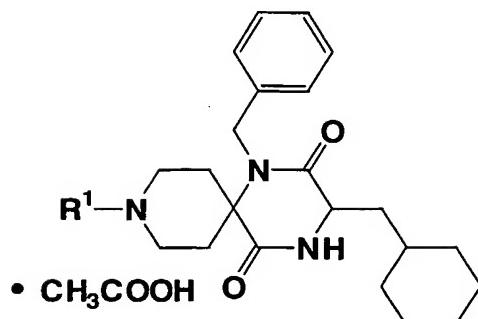
実施例番号	R¹
23 (H30-21)	
23 (H30-22)	
23 (H30-23)	
23 (H30-24)	
23 (H30-25)	

表 30B-5



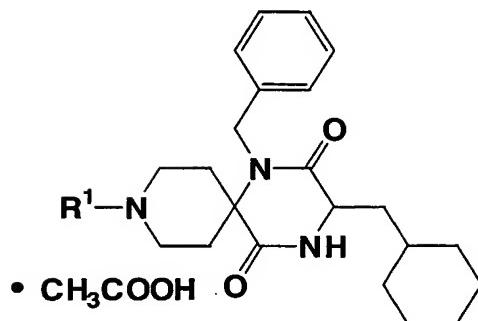
実施例番号	R¹
23 (H30-26)	
23 (H30-27)	
23 (H30-28)	
23 (H30-29)	
23 (H30-30)	
23 (H30-31)	

表 31B-1



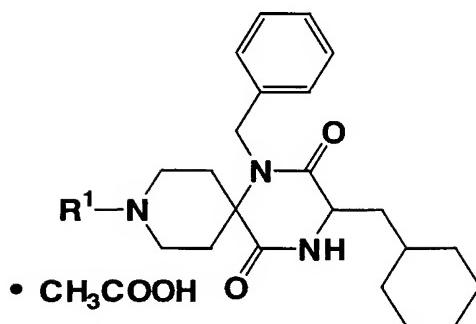
実施例番号	R^1
23 (H31-1)	
23 (H31-2)	
23 (H31-3)	
23 (H31-4)	
23 (H31-5)	
23 (H31-6)	
23 (H31-7)	

表 31B-2



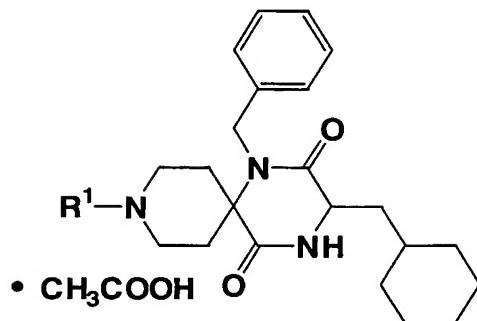
実施例番号	R^1
23 (H31-8)	
23 (H31-9)	
23 (H31-10)	
23 (H31-11)	
23 (H31-12)	
23 (H31-13)	
23 (H31-14)	

表 31B-3



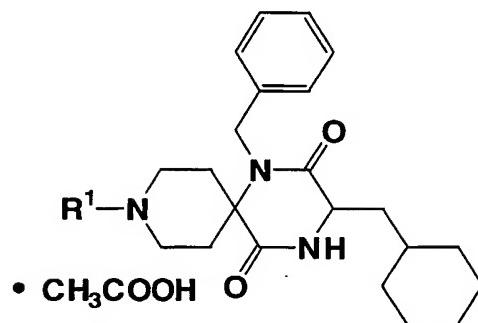
実施例番号	R^1
23 (H31-15)	
23 (H31-16)	
23 (H31-17)	
23 (H31-18)	
23 (H31-19)	
23 (H31-20)	
23 (H31-21)	

表 31B-4



実施例番号	R¹
23 (H31-22)	
23 (H31-23)	
23 (H31-24)	
23 (H31-25)	
23 (H31-26)	

表 31B-5



実施例番号	R^1
23 (H31-27)	
23 (H31-28)	
23 (H31-29)	
23 (H31-30)	
23 (H31-31)	

表 22C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-1)	E	3.67	442 (M + H) ⁺ , 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-2)	E	3.67	442 (M + H) ⁺ , 440, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-3)	E	3.22	400 (M + H) ⁺ , 398, 370, 327.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-4)	E	3.76	476 (M + H) ⁺ , 400.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-5)	E	3.36	586 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-6)	E	3.78	506 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-7)	E	3.73	506 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-8)	E	3.97	520 (M + H) ⁺ , 412, 356.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-9)	E	2.99	477 (M + H) ⁺ , 400.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-10)	E	3.70	442 (M + H) ⁺ , 412, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-11)	E	4.03	526 (M + H) ⁺ , 453, 372.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-12)	E	4.06	482 (M + H) ⁺ , 409.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-13)	E	4.04	526 (M + H) ⁺ , 453, 372.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-14)	E	4.10	540 (M + H) ⁺ , 416.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-15)	E	4.29	582 (M + H) ⁺ , 492.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-16)	E	3.15	416 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-17)	E	4.29	582 (M + H) ⁺ , 492.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-18)	E	3.71	442 (M + H) ⁺ , 440, 412, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-19)	E	4.05	482 (M + H) ⁺ , 452, 409.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-20)	E	3.97	520 (M + H) ⁺ , 478, 412.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-21)	E	3.89	506 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-22)	E	4.02	552 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-23)	E	4.03	522 (M + H) ⁺ , 432, 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-24)	E	3.20	386 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-25)	E	2.93	466 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-26)	E	3.79	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 22C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-27)	E	4.16	586 (M + H) ⁺ , 432, 398, 295.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-28)	E	3.34	556 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-29)	E	3.33	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-30)	E	4.12	625 (M + H) ⁺ , 491.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-31)	E	3.10	486 (M + H) ⁺ , 484.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-32)	E	4.06	526 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-33)	E	4.22	544 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-34)	E	3.90	488 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-35)	E	3.82	456 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-36)	E	3.11	428 (M + H) ⁺ , 355.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-37)	E	4.39	596 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-38)	E	3.18	430 (M + H) ⁺ , 386	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-39)	E	3.12	443 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-40)	E	3.18	430 (M + H) ⁺ , 386, 356.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-41)	E	3.22	400 (M + H) ⁺ , 398, 370, 327.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-42)	E	2.98	477 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-43)	E	3.17	444 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-44)	E	3.32	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-45)	E	4.53	460 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-46)	E	2.26	503 (M + H) ⁺ , 432, 398, 263.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-47)	E	3.20	430 (M + H) ⁺ , 386.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-48)	E	3.87	510 (M + H) ⁺ , 472.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-49)	E	4.11	526 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-50)	E	3.89	494 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-51)	E	3.27	425 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-52)	E	3.74	515 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 22C-3

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-53)	E	4.19	625 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-54)	E	3.93	534 (M + H) ⁺ , 458.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-55)	E	4.08	667 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-56)	E	3.94	534 (M + H) ⁺ , 458.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-57)	E	4.02	591 (M + H) ⁺ , 457.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-58)	E	3.79	506 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-59)	E	4.01	591 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-60)	E	3.91	577 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-61)	E	3.47	586 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-62)	E	3.94	520 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-63)	E	4.33	552 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-64)	E	4.21	552 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 23C

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H23-1)	E	3.00	444 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-2)	E	3.07	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-3)	E	2.52	457 (M + H) ⁺ , 296, 162.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-4)	E	3.17	480 (M + H) ⁺ , 296, 217, 185.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-5)	E	3.80	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-6)	E	3.79	478 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-7)	E	3.43	442 (M + H) ⁺ , 402, 336, 296.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-8)	E	3.86	498 (M + Na) ⁺ , 476 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-9)	E	2.90	452 (M + H) ⁺ , 296.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-10)	E	3.57	484 (M + H) ⁺ , 332.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-11)	E	3.62	456 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-12)	E	3.22	497 (M + H) ⁺ , 336, 162.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-13)	E	3.69	520 (M + H) ⁺ , 185.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-14)	E	4.16	532 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-15)	E	4.16	518 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-16)	E	3.89	482 (M + H) ⁺ , 442, 376, 336.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-17)	E	4.21	516 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-18)	E	3.48	492 (M + H) ⁺ , 336, 189, 157.	APCI (Pos., 40 V)

表 24C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H24-1)	F	3.07	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-2)	F	3.11	452 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-3)	F	3.04	362 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-4)	F	3.16	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-5)	F	3.07	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-6)	F	3.12	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-7)	F	2.74	359 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-8)	F	3.18	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-9)	F	2.76	362 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-10)	F	2.76	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-11)	F	3.35	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-12)	F	3.38	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-13)	F	3.12	397 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-14)	F	2.87	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-15)	F	2.92	408 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-16)	F	2.89	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-17)	F	3.18	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-18)	F	3.01	412 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-19)	F	3.44	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-20)	F	3.11	455 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-21)	F	3.53	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-22)	F	3.12	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-23)	F	3.49	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-24)	F	3.42	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-25)	F	3.16	439 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-26)	F	3.57	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 24C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H24-27)	F	3.18	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-28)	F	3.33	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-29)	F	3.38	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-30)	F	3.16	495 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-31)	F	3.38	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 25C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H25-1)	F	3.16	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-2)	F	3.18	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-3)	F	3.11	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-4)	F	3.23	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-5)	F	3.16	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-6)	F	3.20	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-7)	F	3.28	425 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-8)	F	2.85	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-9)	F	2.89	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-10)	F	3.44	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-11)	F	3.18	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-12)	F	3.45	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-13)	F	2.96	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-14)	F	3.27	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-15)	F	3.09	426 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-16)	F	3.53	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-17)	F	3.18	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-18)	F	3.60	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-19)	F	3.22	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-20)	F	3.55	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-21)	F	3.49	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-22)	F	3.25	453 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-23)	F	3.64	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-24)	F	3.25	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-25)	F	3.42	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-26)	F	3.47	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 25C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H25-27)	F	3.24	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-28)	F	3.47	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 26C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H26-1)	F	3.25	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-2)	F	3.26	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-3)	F	3.22	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-4)	F	3.33	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-5)	F	3.23	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-6)	F	3.29	404 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-7)	F	2.93	387 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-8)	F	3.34	439 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-9)	F	2.93	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-10)	F	2.97	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-11)	F	3.50	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-12)	F	3.52	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-13)	F	3.28	425 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-14)	F	3.04	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-15)	F	3.11	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-16)	F	3.04	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-17)	F	3.35	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-18)	F	3.20	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-19)	F	3.58	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-20)	F	3.25	483 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-21)	F	3.68	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-22)	F	3.30	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-23)	F	3.62	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-24)	F	3.57	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-25)	F	3.33	467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-26)	F	3.71	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 26C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H26-27)	F	3.33	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-28)	F	3.49	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-29)	F	3.52	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-30)	F	3.32	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-31)	F	3.55	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-1)	F	3.31	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-2)	F	3.33	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-3)	F	3.31	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-4)	F	3.55	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-5)	F	3.58	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-6)	F	3.33	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-7)	F	3.16	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-8)	F	3.18	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-9)	F	3.31	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-10)	F	3.33	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-11)	F	3.33	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-12)	F	3.58	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-13)	F	3.60	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-14)	F	3.34	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-15)	F	3.18	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-16)	F	3.22	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-17)	F	3.29	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-18)	F	3.33	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-19)	F	3.56	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-20)	F	3.58	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-21)	F	3.33	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-22)	F	3.18	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-23)	F	3.20	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-24)	F	3.29	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-25)	F	3.31	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-26)	F	3.55	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-27)	F	3.56	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-28)	F	3.33	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-29)	F	3.17	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-30)	F	3.20	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-31)	F	2.92	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-32)	F	2.97	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-33)	F	2.96	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-34)	F	3.22	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-35)	F	3.25	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-36)	F	3.00	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-37)	F	2.87	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-38)	F	2.83	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-39)	F	2.90	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-40)	F	2.94	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-41)	F	2.92	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-42)	F	3.16	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-43)	F	3.20	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-44)	F	2.98	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-45)	F	2.85	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-46)	F	2.81	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-47)	F	2.89	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-48)	F	2.94	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-49)	F	2.92	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-50)	F	3.16	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-51)	F	3.18	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-52)	F	2.98	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-3

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-53)	F	2.83	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-54)	F	2.81	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-55)	F	3.33	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-56)	F	3.36	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-57)	F	3.34	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-58)	F	3.60	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-59)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-60)	F	3.36	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-61)	F	3.20	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-62)	F	3.23	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-63)	F	3.36	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-64)	F	3.38	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-65)	F	3.36	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-66)	F	3.62	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-67)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-68)	F	3.38	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-69)	F	3.23	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-70)	F	3.25	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-71)	F	3.36	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-72)	F	3.38	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-73)	F	3.36	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-74)	F	3.62	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-75)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-76)	F	3.36	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-77)	F	3.22	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-78)	F	3.23	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 28C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H28-1)	F	3.36	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-2)	F	3.37	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-3)	F	3.31	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-4)	F	3.42	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-5)	F	3.35	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-6)	F	3.41	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-7)	F	3.04	413 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-8)	F	3.45	465 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-9)	F	3.03	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-10)	F	3.77	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-11)	F	3.61	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-12)	F	3.61	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-13)	F	3.15	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-14)	F	3.22	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-15)	F	3.16	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-16)	F	3.46	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-17)	F	3.29	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-18)	F	3.68	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-19)	F	3.36	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-20)	F	3.76	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-21)	F	3.42	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-22)	F	3.71	580 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-23)	F	3.66	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-24)	F	3.44	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-25)	F	3.79	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-26)	F	3.42	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 28C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H28-27)	F	3.58	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-28)	F	3.62	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-29)	F	3.42	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-30)	F	3.62	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 29C-1

実施例番号	HPLC条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H29-1)	F	3.44	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-2)	F	3.44	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-3)	F	3.42	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-4)	F	3.53	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-5)	F	3.44	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-6)	F	3.49	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-7)	F	3.09	427 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-8)	F	3.53	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-9)	F	3.11	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-10)	F	3.14	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-11)	F	3.67	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-12)	F	3.69	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-13)	F	3.47	465 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-14)	F	3.23	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-15)	F	3.29	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-16)	F	3.24	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-17)	F	3.55	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-18)	F	3.35	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-19)	F	3.73	576 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-20)	F	3.44	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-21)	F	3.83	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-22)	F	3.49	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-23)	F	3.77	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-24)	F	3.72	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-25)	F	3.52	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-26)	F	3.85	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 29C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H29-27)	F	3.51	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-28)	F	3.66	538 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-29)	F	3.69	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-30)	F	3.47	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-31)	F	3.68	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 30C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H30-1)	F	3.27	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-2)	F	3.31	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-3)	F	3.24	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-4)	F	3.34	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-5)	F	3.29	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-6)	F	3.33	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-7)	F	2.98	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-8)	F	3.38	481 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-9)	F	2.98	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-10)	F	3.01	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-11)	F	3.51	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-12)	F	3.55	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-13)	F	3.33	467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-14)	F	3.09	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-15)	F	3.16	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-16)	F	3.09	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-17)	F	3.36	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-18)	F	3.22	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-19)	F	3.60	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-20)	F	3.31	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-21)	F	3.69	630 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-22)	F	3.33	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-23)	F	3.64	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-24)	F	3.59	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-25)	F	3.34	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-26)	F	3.71	630 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 30C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H30-27)	F	3.34	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-28)	F	3.51	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-29)	F	3.53	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-30)	F	3.34	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-31)	F	3.55	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 31C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H31-1)	F	3.47	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-2)	F	3.47	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-3)	F	3.45	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-4)	F	3.55	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-5)	F	3.47	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-6)	F	3.53	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-7)	F	3.14	461 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-8)	F	3.56	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-9)	F	3.14	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-10)	F	3.20	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-11)	F	3.69	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-12)	F	3.71	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-13)	F	3.51	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-14)	F	3.27	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-15)	F	3.33	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-16)	F	3.29	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-17)	F	3.58	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-18)	F	3.40	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-19)	F	3.75	610 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-20)	F	3.49	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-21)	F	3.86	662 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-22)	F	3.53	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-23)	F	3.80	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-24)	F	3.75	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-25)	F	3.57	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-26)	F	3.86	662 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 31C-2

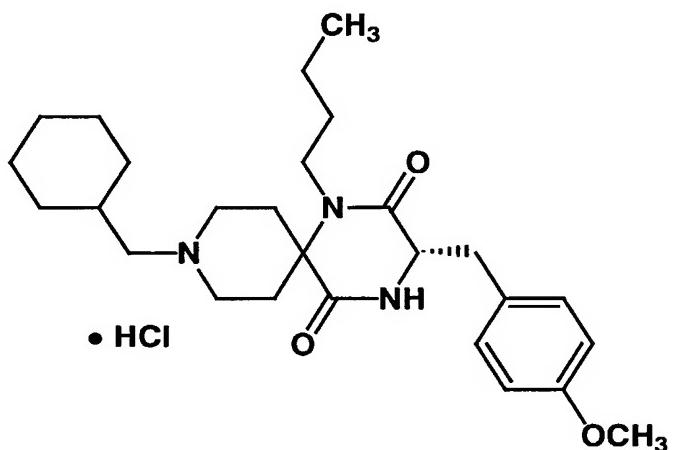
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H31-27)	F	3.53	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-28)	F	3.67	572 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-29)	F	3.71	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-30)	F	3.51	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-31)	F	3.73	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

実施例 24 (1) ~ 24 (119)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドンと、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカルボニル) ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3 → 参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-ホルミルピラゾールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 5 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

実施例 24 (1)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシフェニルメチル)-9-シクロヘキシリルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

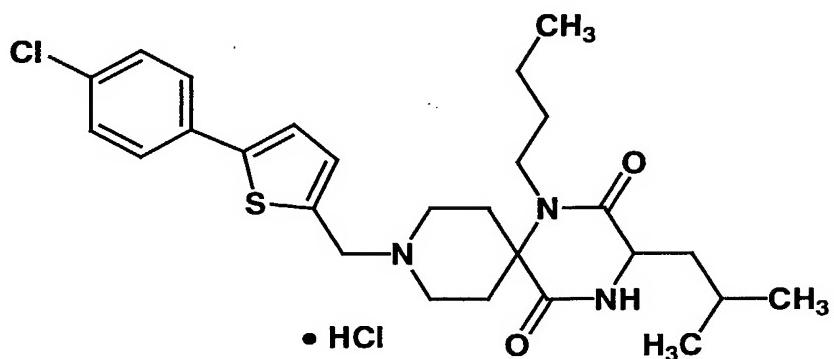


TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (dd, J = 4.5, 3.6 Hz, 1H), 3.82-3.67 (m, 4H), 3.49-3.30 (m, 3H), 3.25 (dd, J = 13.8, 3.6 Hz, 1H), 3.23-3.10 (m, 2H), 2.95-2.87 (m, 2H), 2.87 (dd, J = 13.8, 4.5 Hz, 1H), 2.31 (m, 1H), 2.05 (m, 1H), 1.91-1.64 (m, 7H), 1.56-1.14 (m, 7H), 1.09-0.91 (m,

5H), 0.26 (m, 1H)。

実施例 2 4 (2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-
5 (4-クロロフェニル)チオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

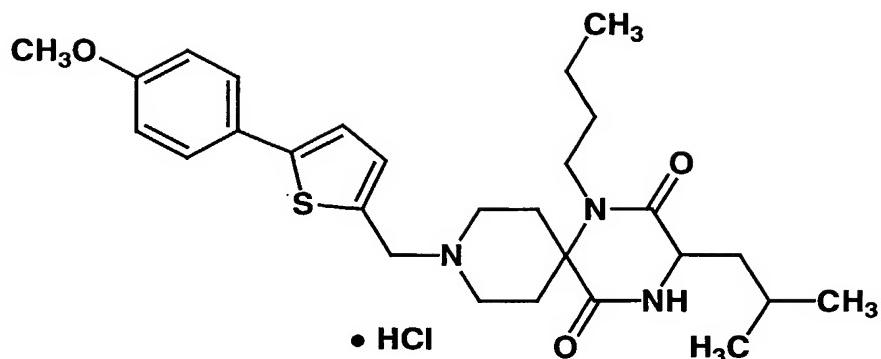


TLC : Rf 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.65 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H), 4.61 (brs, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.95-3.72 (m, 2H), 3.65-3.50 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.50-2.12 (m, 4H), 1.89-1.45 (m, 5H), 1.45-1.28 (m, 2H), 1.13-0.89 (m, 9H)。

実施例 2 4 (3)

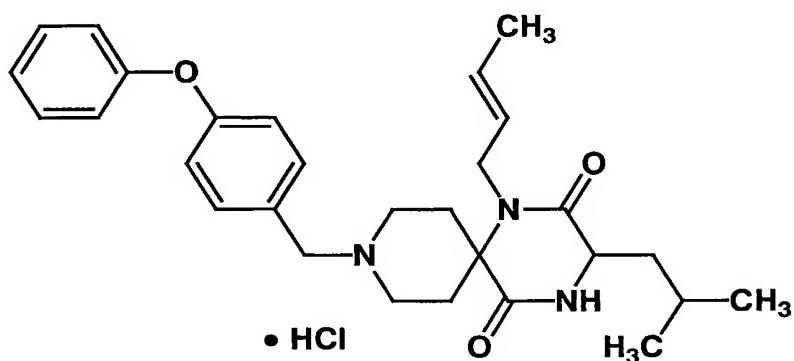
15 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-
(4-メトキシフェニル)チオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.33-7.26 (m, 2H), 6.97 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.58 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.71 (m, 5H), 3.64-5 3.50 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.49-2.12 (m, 4H), 1.90-1.45 (m, 5H), 1.45-1.28 (m, 2H), 1.03-0.88 (m, 9H)。

実施例 24 (4)

1 - ((2E)-2-ブテニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルブロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

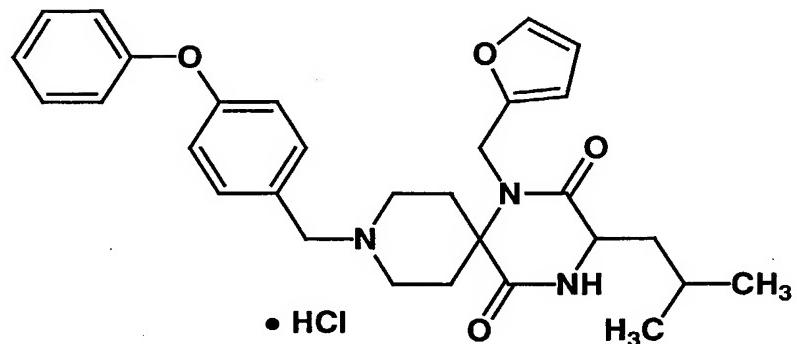


TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.22-7.14 (m, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10-7.00 (m, 2H), 5.75-5.60 (m, 1H), 5.52-5.38 (m,

1H), 4.33 (s, 2H), 4.15-3.93 (m, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.66 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 2.52-2.35 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.57 (m, 3H), 1.65 (dd, J = 6.3, 1.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 2 4 (5)

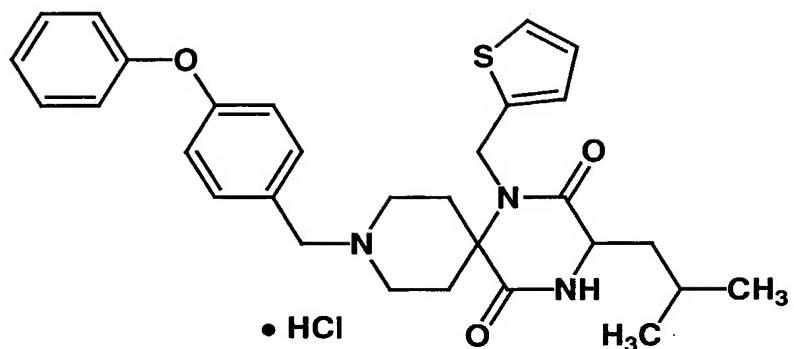
1 - (フラン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



10 T L C : R_f 0.33 (クロロホルム:メタノール=20:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 3H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-6.99 (m, 4H), 6.33 (m, 1H), 6.28 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 4.69 (s, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.08 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.72 (m, 2H), 3.57-3.42 (m, 2H), 2.65-2.38 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 15 0.91 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (6)

1 - (チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩
 20

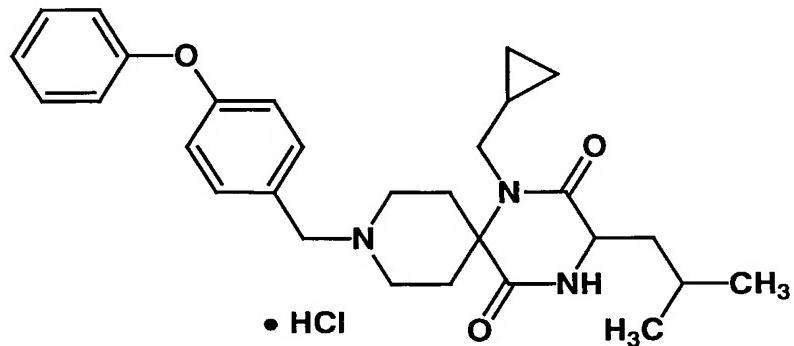


TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.34 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 5.1, 1.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 5H), 6.91 (dd, J = 5.1, 3.3 Hz, 1H), 4.92 (brs, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.11 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 2H), 2.68-2.46 (m, 2H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.95-1.59 (m, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 6H)。

実施例 24 (7)

- 10 1-シクロプロピルメチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

- 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.2

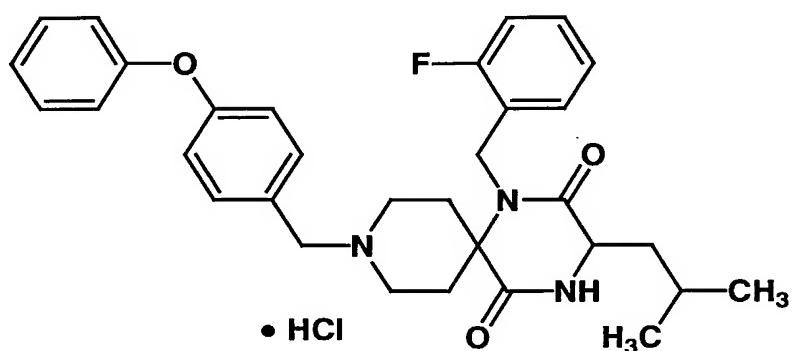
Hz, 1H), 7.08-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.87-3.68 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.56-2.35 (m, 2H), 2.23-2.12 (m, 2H), 1.95-1.58 (m, 3H), 1.10-0.95 (m, 1H), 0.95 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 0.56-0.45 (m, 2H), 0.42-0.34 (m, 2H)。

5

実施例 2 4 (8)

1-(2-フルオロフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

10

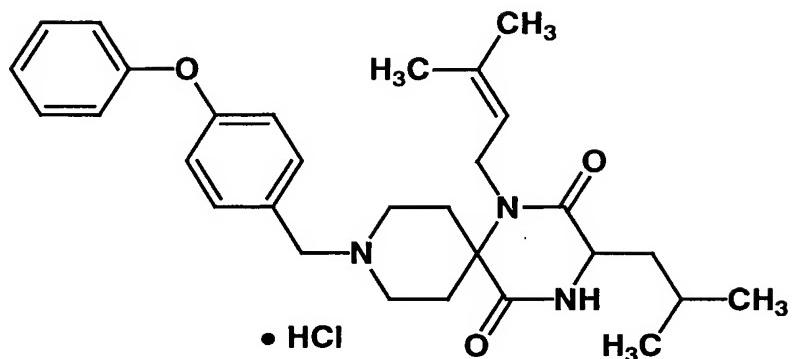


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.42-7.34 (m, 2H), 7.32-7.21 (m, 1H), 7.17 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.14-7.06 (m, 3H), 7.06-6.98 (m, 4H), 4.80 (brs, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.18 (dd, $J = 8.1, 4.8$ Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.50-3.35 (m, 2H), 2.50-2.30 (m, 1H), 2.30-2.14 (m, 3H), 1.94-1.62 (m, 3H), 0.97 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H)。

実施例 2 4 (9)

1-(3-メチル-2-ブテニル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-ト

リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

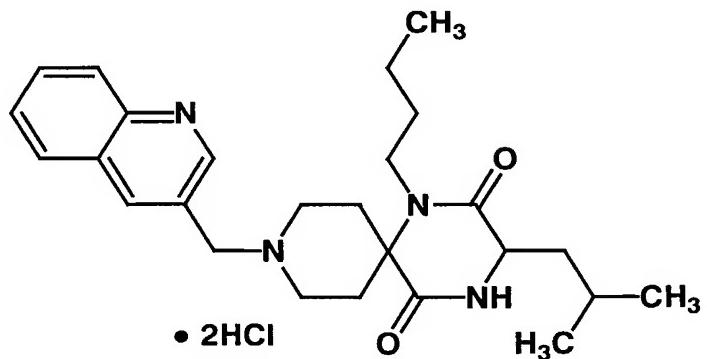


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.97 (br, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.20-4.00 (m, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.55-3.45 (m, 2H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 24 (10)

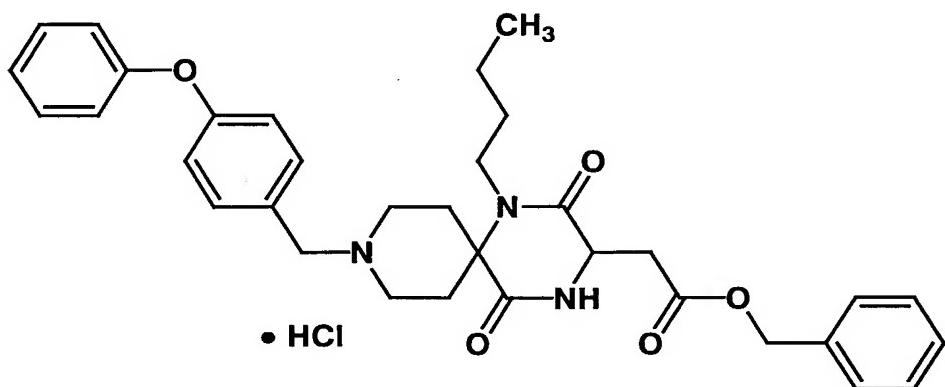
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(キノリン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.52 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.24-8.16 (m, 1H), 8.04-7.96 (m, 1H),
 5 4.76 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.00-3.85 (m, 2H), 3.68-3.55 (m, 2H),
 3.55-3.43 (m, 2H), 2.76-2.56 (m, 2H), 2.27-2.05 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H),
 1.05-0.83 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (11)

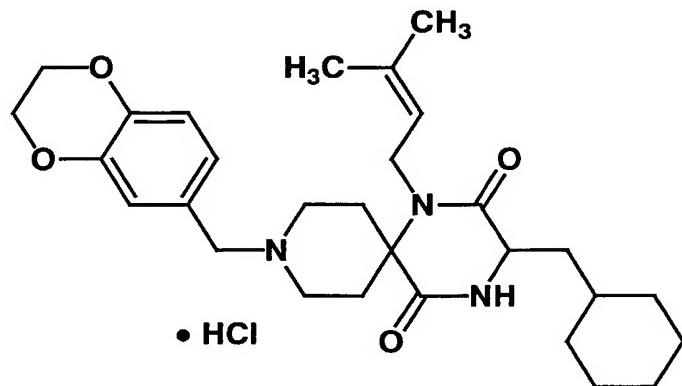
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシカルボニルメチル)
 10 -9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.74 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.33 (m,
 15 5H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.05 (m, 4H), 5.12 (s, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.31 (m,
 1H), 3.88 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.50-3.35 (m, 4H), 3.08 (dd, J = 17.7, 4.8 Hz,
 1H), 2.86 (dd, J = 17.7, 3.0 Hz, 1H), 2.34 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.50 (m, 2H),
 1.36 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (1 2)

1 - (3 - メチル - 2 - プテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

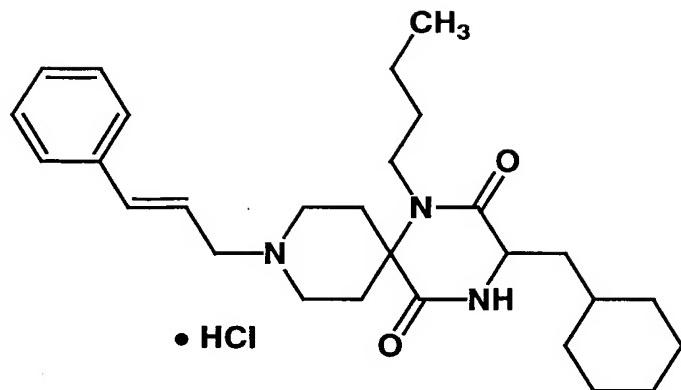


5

TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (s, 2H), 4.10-4.00 (m, 3H),
 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 2H), 2.43-2.08 (m, 4H), 1.84-1.42 (m, 13H),
 1.38-1.12 (m, 4H), 1.04-0.85 (m, 2H)。

実施例 2 4 (1 3)

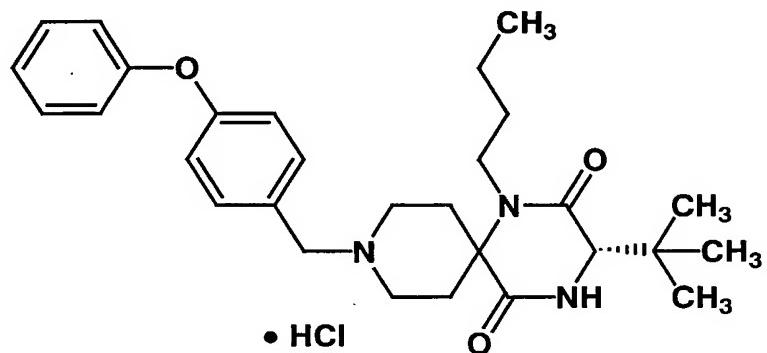
1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - ((2E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53-7.48 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 3H), 6.95 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 6.36 (dd, J = 16.2, 8.1 Hz, 1H), 4.07 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.86-3.75 (m, 2H), 3.60-3.52 (m, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.42-2.18 (m, 4H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (14)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1,1-ジメチルエチル)
 10 -9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

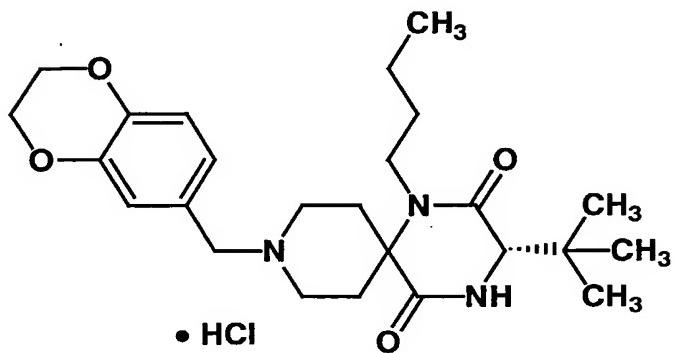


TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz,

1H), 7.08-7.02 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 3.88 (m, 2H), 3.62 (s, 1H), 3.46 (m, 4H), 2.45 (m, 2H), 2.13 (m, 2H), 1.66-1.47 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 1.02 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

5 実施例 2 4 (1 5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1,1-ジメチルエチル)-9-(1,4-ペンソジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

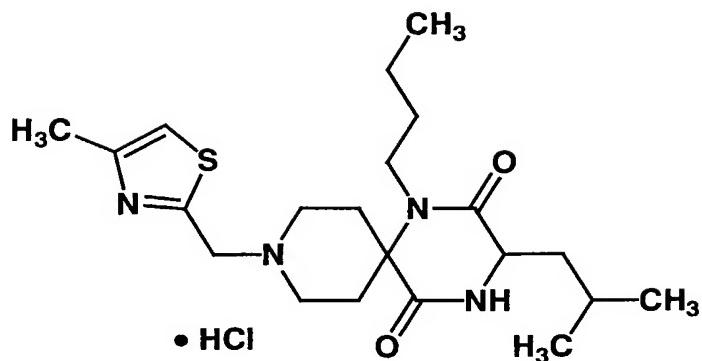


10 TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.07 (m, 1H), 6.99 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.26 (m, 4H), 4.24 (s, 2H), 3.83 (m, 2H), 3.62 (s, 1H), 3.45 (m, 4H), 2.42 (m, 2H), 2.11 (m, 2H), 1.64-1.5 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 1.01 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

15

実施例 2 4 (1 6)

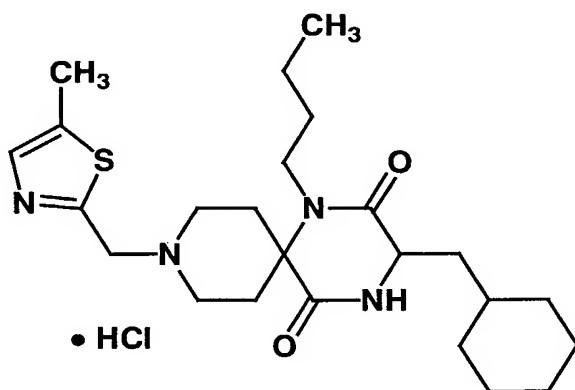
1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (s, 1H), 4.73 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.93
 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 2.53-2.41 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.23 (m,
 5) 2H), 1.85-1.52 (m, 5H), 1.38 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz,
 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (17)

1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5 - メ
 10 チルチアゾール - 2 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5]
 ウンデカン・塩酸塩

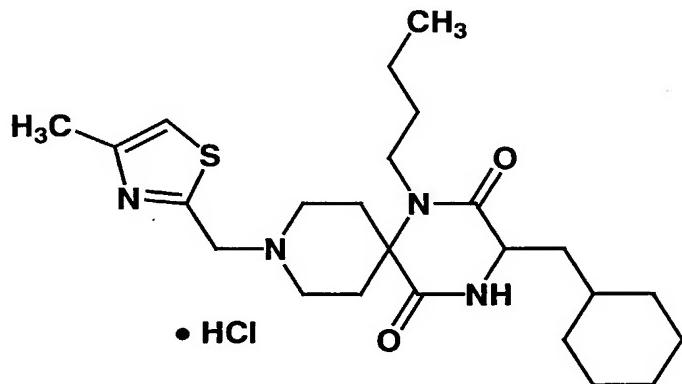


TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (s, 1H), 4.72 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),

3.98-3.86 (m, 2H), 3.67-3.63 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H), 2.56-2.42 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.30-2.14 (m, 2H), 1.84-1.18 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

5 実施例 24 (18)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

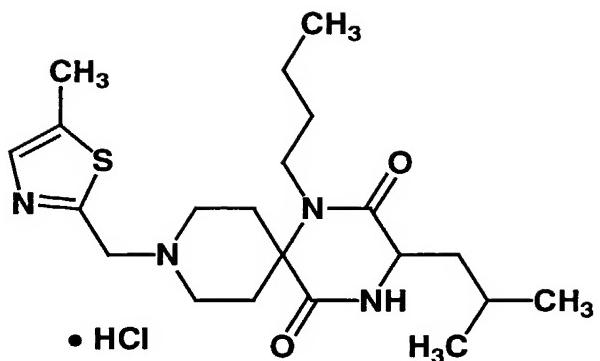


10 TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.63 (s, 1H), 4.69 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.3, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.82 (m, 2H), 3.72-3.58 (m, 2H), 3.42-3.37 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.56-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

15

実施例 24 (19)

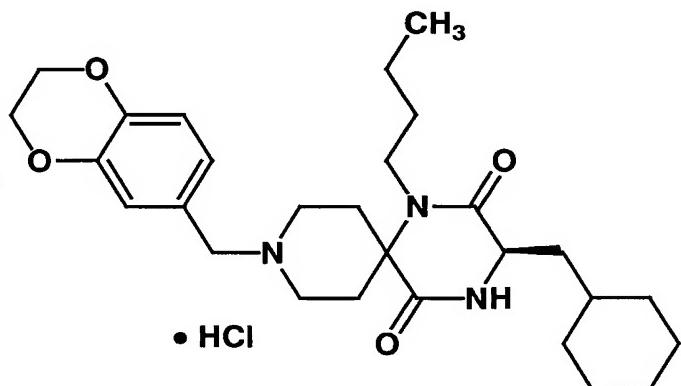
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.63 (s, 1H), 4.69 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H),
 3.99-3.83 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.50-2.33
 5 (m, 2H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.88-1.46 (m, 5H), 1.45-1.31 (m, 2H), 1.01-0.90 (m,
 9H)。

実施例 24 (20)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 10 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93

(d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 5.0$ Hz, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.46 (m, 4H), 2.39-2.11 (m, 4H), 1.78-1.17 (m, 15H), 0.95 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

HPLC 条件

5 使用したカラム：YMC CHIRAL-CD BR、0.46 × 25cm、YMC、DB12S05-2546WTI；

使用した流速：0.5mL/min；

使用した溶媒

A液：0.1Mリン酸二水素カリウム水溶液

10 B液：アセトニトリル

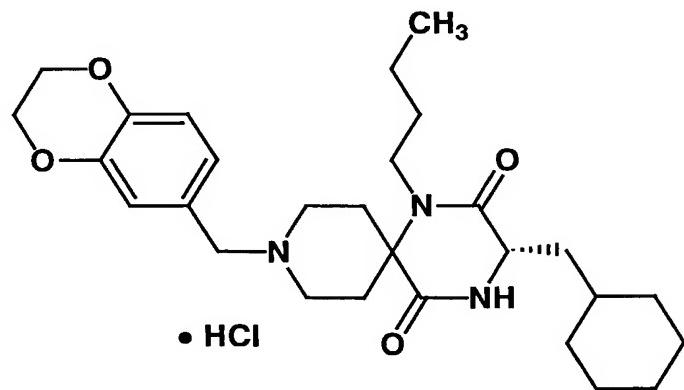
A : B = 84 : 16；

使用したUV：235 nm；

保持時間：18 min。

15 実施例24(21)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザ
スピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93
 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 5.0 Hz, 1H), 3.76
 (m, 2H), 3.46 (m, 4H), 2.39-2.11 (m, 4H), 1.78-1.17 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.0
 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

HPLC条件

使用したカラム : YMC CHIRAL-CD BR、0.46 × 25cm、YMC、DB12S05-2546WTI；

使用した流速 : 0.5 mL/min；

10 使用した溶媒

A液 : 0.1Mリン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

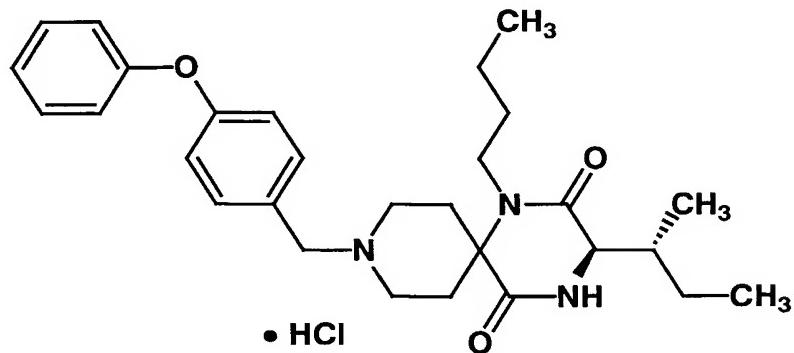
A : B = 84 : 16；

使用したUV : 235 nm；

15 保持時間 : 20 min。

実施例24(22)

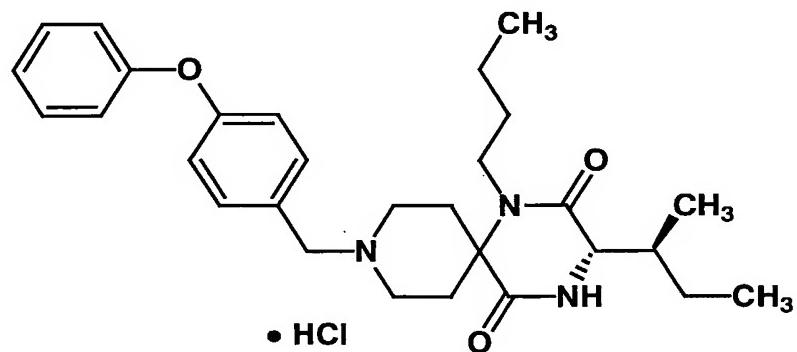
(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-メチルブロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリ
 20 アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 3.96 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.53-3.44 (m, 4H), 2.49-2.32 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 2.06-1.98 (m, 1H),
 5 1.61-1.21 (m, 6H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 24 (23)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリ
 10 アザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

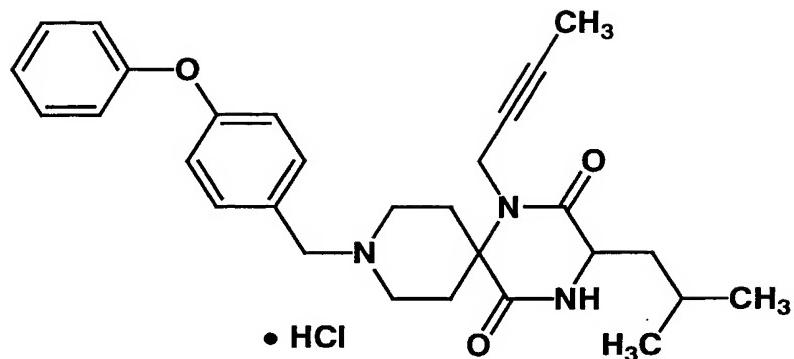


TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 3.96 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.53-3.44 (m, 4H), 2.49-2.32 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 2.06-1.98 (m, 1H),
 15 1.61-1.21 (m, 6H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 24 (24)

1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 20 9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン・塩酸塩

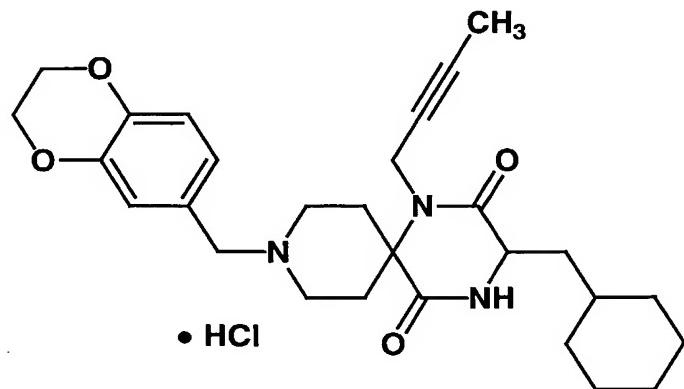


TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.2 Hz, 2H), 7.18
 5 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.28-4.10 (m, 2H), 4.05 (dd,
 J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 2.59-2.40 (m, 2H),
 2.34-2.15 (m, 2H), 1.89-1.57 (m, 6H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz,
 3H)。

10 実施例 24 (25)

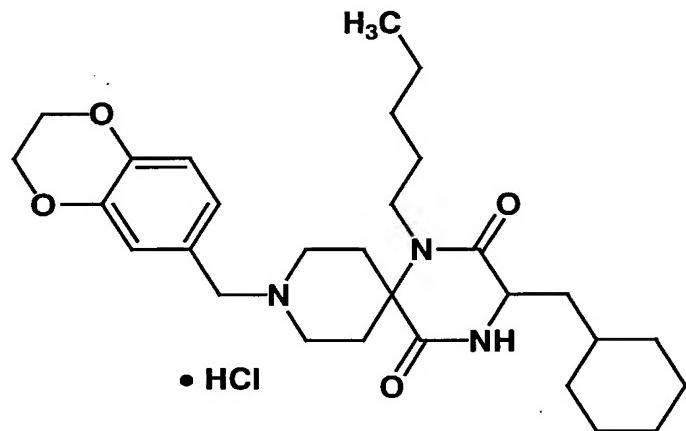
1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザ
 スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93
 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.18 (brs, 2H), 4.07 (dd, J = 6.9,
 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 2.57-2.40 (m, 2H), 2.32-2.12
 (m, 2H), 1.85-1.42 (m, 11H), 1.38-1.13 (m, 3H), 1.04-0.85 (m, 2H)。
 5

実施例 24 (26)

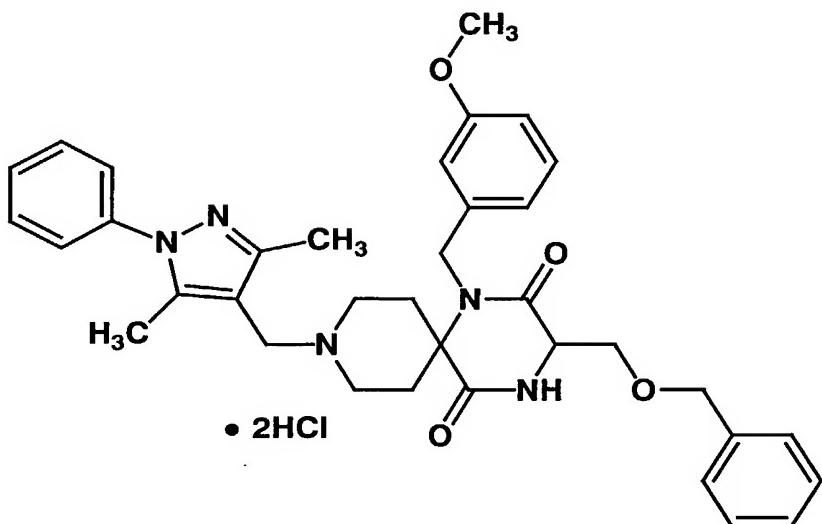
1-ペンチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1,
 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
 10 10]ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.92
 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.5 Hz, 1H),
 15 3.84-3.67 (m, 2H), 3.52-3.33 (m, 4H), 2.43-2.07 (m, 4H), 1.83-1.42 (m, 9H),
 1.41-1.13 (m, 8H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

実施例 24 (27)

1-(3-メトキシフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

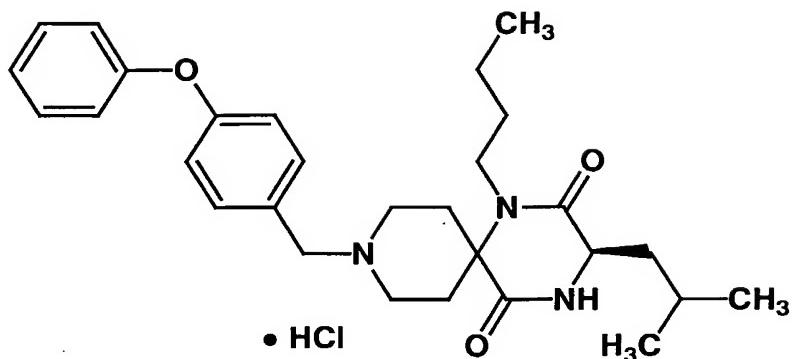


5

TLC : Rf 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.60-7.43 (m, 5H), 7.38-7.24 (m, 5H), 7.14 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 6.83-6.72 (m, 3H), 4.96-4.70 (m, 2H), 4.60 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.29 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H), 3.93-3.79 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.70 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H), 3.70-3.60 (m, 1H), 3.55-3.44 (m, 1H), 3.35-3.23 (m, 1H), 2.58-2.05 (m, 10H).

実施例24(28)

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H),
 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05 - 7.02 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8
 Hz, 1H), 3.85-3.72 (m, 2H), 3.50-3.39 (m, 4H), 2.52-2.38 (m, 2H), 2.24-2.11 (m,
 2H), 1.84-1.20 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d,
 J = 6.3 Hz, 3H)。

HPLC 条件

使用したカラム : CHIRALCEL OD-R, 0.46 × 25cm, DAICEL, ODR0CE-HD028;

10 使用した流速 : 0.4 mL/min ;

使用した溶媒

A液 : 0.2M リン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

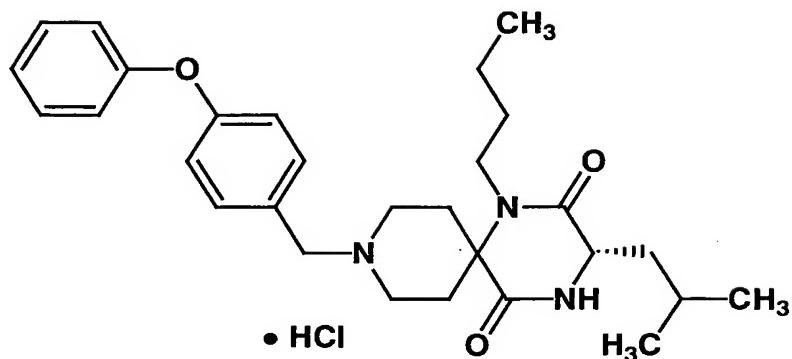
A : B = 64 : 36 ;

15 使用したUV : 235 nm ;

保持時間 : 30 min.

実施例24(29)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 20 9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ
 [5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H),

7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 3.98 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.53-3.37 (m, 4H), 2.47-2.36 (m, 2H), 2.24-2.12 (m, 2H), 1.80-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

HPLC条件

使用したカラム : CHIRALCEL OD-R, 0.46 × 25cm, DAICEL, ODR0CE-HD028;

10 使用した流速 : 0.4 mL / min ;

使用した溶媒

A液 : 0.2Mリン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

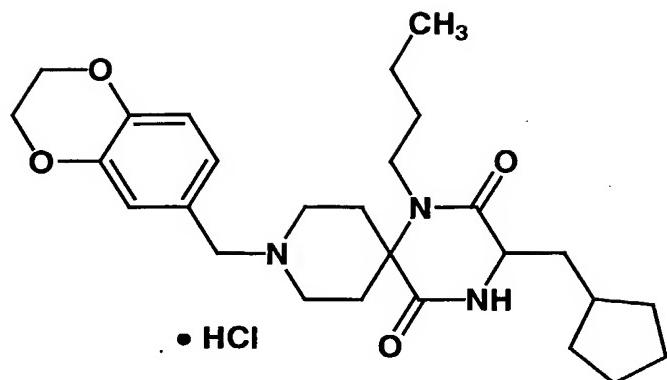
A : B = 64 : 36 ;

15 使用したUV : 235 nm ;

保持時間 : 28 min.

実施例24(30)

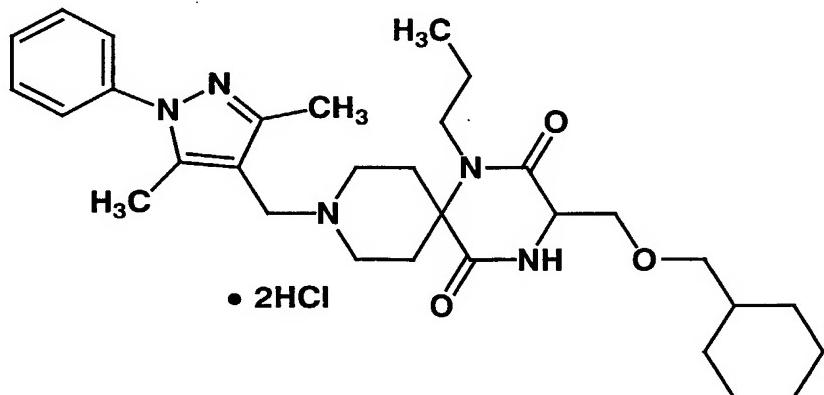
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93
 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.99 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.77 (m,
 5 2H), 3.46 (m, 2H), 3.37 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.96 (m, 1H), 1.81
 (m, 4H), 1.59 (m, 6H), 1.36 (m, 2H), 1.15 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (31)

1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシリメチルオキシメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

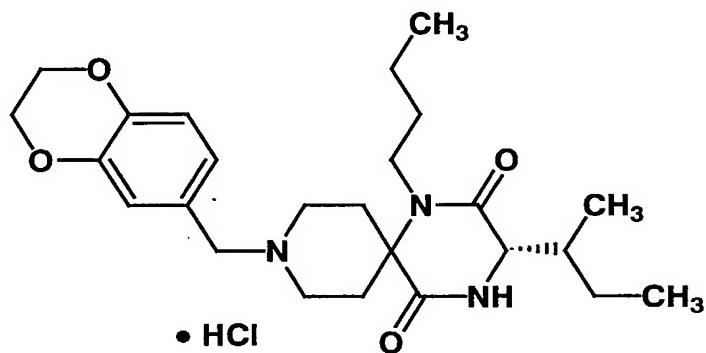
NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.46 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.08 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.77 (m, 1H), 3.59 (m, 2H), 3.52 (m, 1H), 3.25 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 2.53 (m, 2H), 2.42 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.69 (m, 6H), 1.52 (m, 2H), 1.21 (m, 4H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.88 (m, 2H)。

5

実施例 24 (32)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

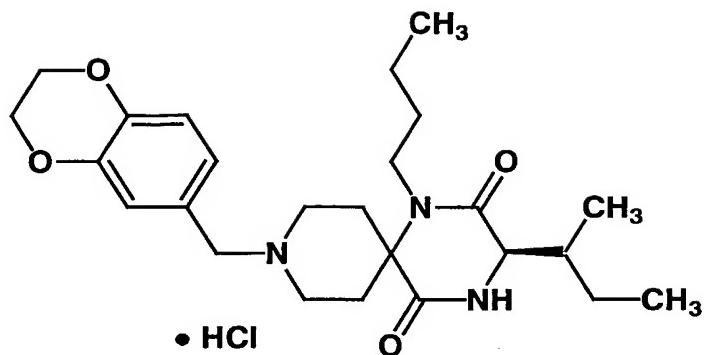
10



TLC : Rf 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.90 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.95 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 4H), 2.56-2.30 (m, 2H), 2.20-1.98 (m, 2H), 1.54-1.00 (m, 7H), 0.99 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (33)

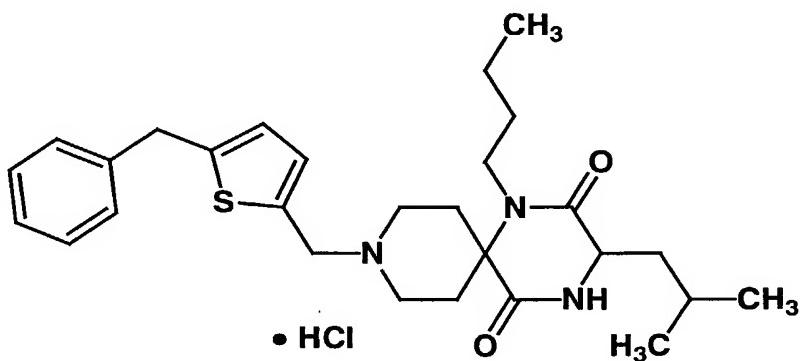
(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.91 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.95 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.56-3.40 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.18-1.96 (m, 2H), 1.62-1.17 (m, 7H), 0.99 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例24(34)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルメチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

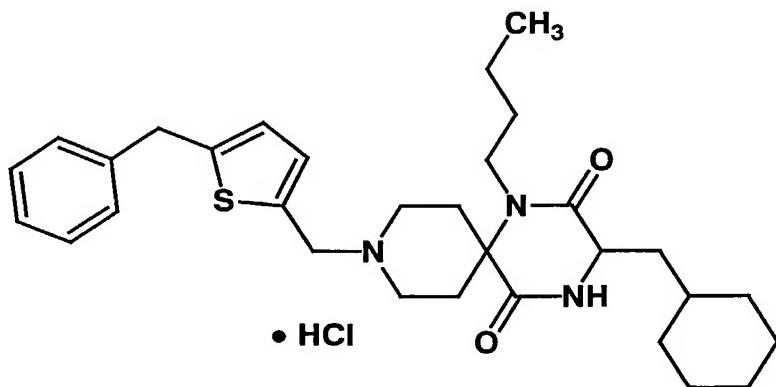


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム:メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.32-7.21 (m, 5H), 7.17 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.6
 15 Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8 Hz, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.72 (m,

2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.38-3.32 (m, 2H), 2.42-2.14 (m, 4H), 1.84-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (35)

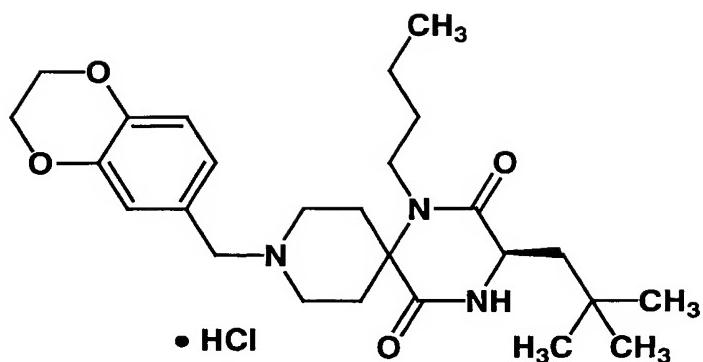
- 5 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-フェニルメチルチオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- TLC : Rf 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 10 NMR (CD_3OD) : δ 7.32-7.21 (m, 5H), 7.18 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.72 (m, 2H), 3.58-3.44 (m, 2H), 3.40-3.36 (m, 2H), 2.44-2.08 (m, 4H), 1.81-1.07 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 24 (36)

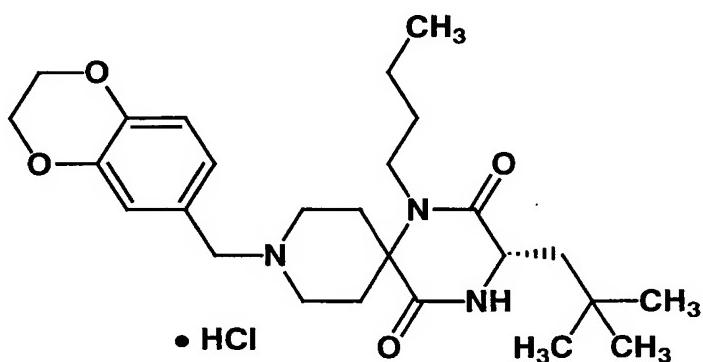
(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.0, 3.0 Hz, 1H), 3.83 - 3.64 (m, 2H), 5 3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.55 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (37)

(3S)-1-(2,2-dimethylpropyl)-5-((2-methoxyphenyl)methyl)piperidin-3-one
 10 (1,4-benzodioxane-6-ylmethyl)-1,4,9-triaspiro[5.5]undecan hydrochloride

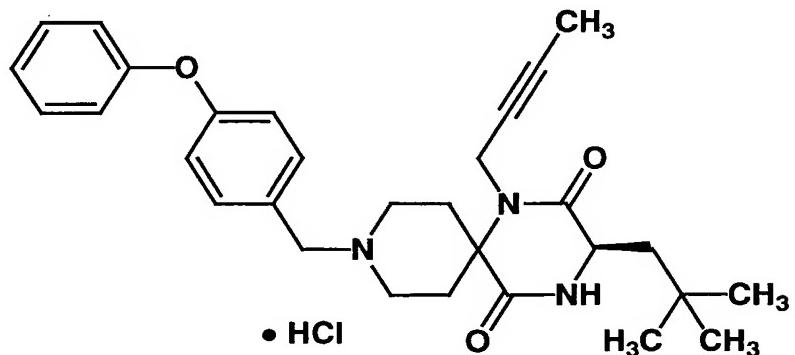


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.0, 3.0 Hz, 1H), 3.83 - 3.63 (m, 2H), 15 3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.55 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (dd, J = 14.0, 3.0 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.0 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

5 実施例 24 (38)

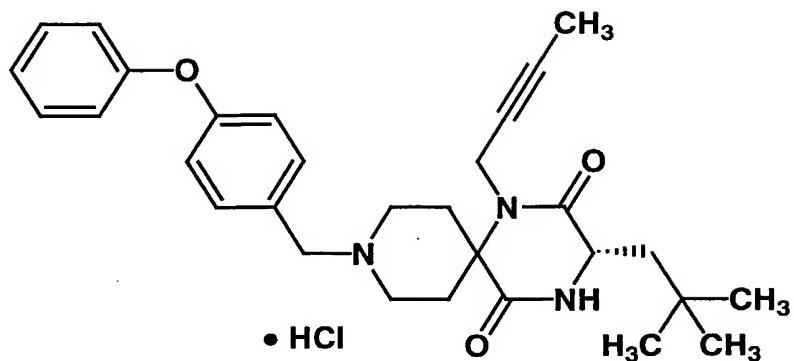
(3R)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(2,2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.33-4.09 (m, 2H), 4.03 (dd, J = 6.9, 3.3 Hz, 1H), 3.85-3.68 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 2.59-2.41 (m, 2H), 2.40-2.20 (m, 2H), 2.03 (dd, J = 14.4, 3.3 Hz, 1H), 1.75 (brs, 3H), 1.56 (dd, J = 14.4, 6.9 Hz, 1H), 0.99 (s, 9H)。
 15

実施例 24 (39)

(3S)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(2,2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩
 20



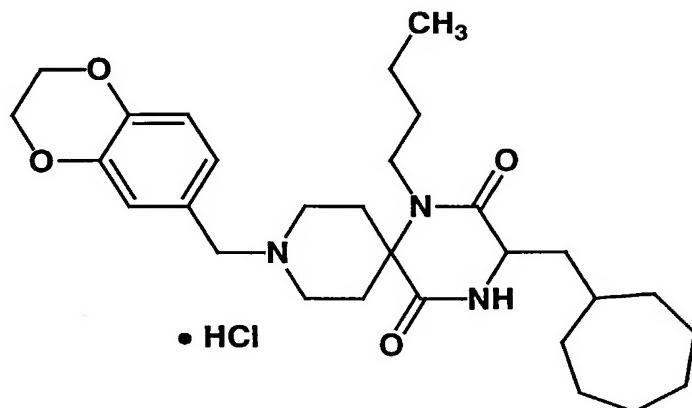
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18

(t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.33-4.09 (m, 2H), 4.03 (dd, 5 J = 6.9, 3.3 Hz, 1H), 3.85-3.68 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 2.59-2.41 (m, 2H), 2.40-2.20 (m, 2H), 2.03 (dd, J = 14.4, 3.3 Hz, 1H), 1.75 (brs, 3H), 1.56 (dd, J = 14.4, 6.9 Hz, 1H), 0.99 (s, 9H)。

実施例 24 (40)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘプチルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



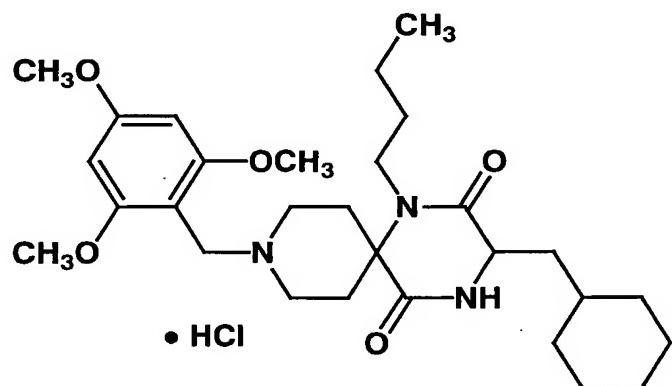
TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 2.37-2.11 (m, 4H), 1.80-1.49 (m, 15H), 1.36 (m, 2H), 1.22 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

5

実施例 24 (4 1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



10

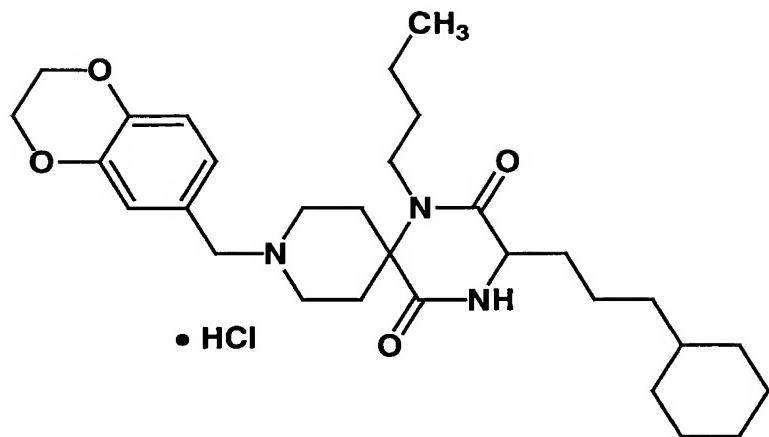
TLC : Rf 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 6.31 (s, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.89 (s, 6H), 3.84 (s, 3H), 3.84-3.73 (m, 2H), 3.54-3.33 (m, 4H), 2.44-2.25 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 1.06-0.85 (m, 5H)。

15

実施例 24 (4 2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



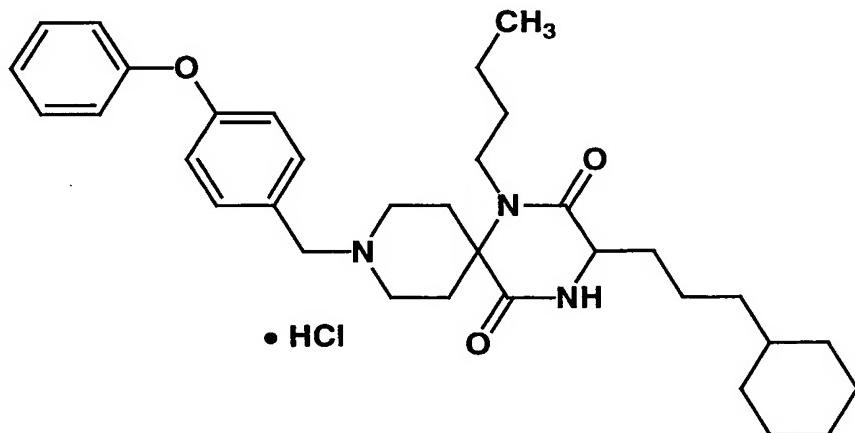
TLC : R_f 0.71 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05-6.91 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (s, 2H), 4.04 (t, J = 5.4 Hz, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.67 (m, 1H), 3.54-3.40 (m, 3H), 3.35 (m, 1H), 2.44-2.08 (m, 4H), 1.90-1.16 (m, 19H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 24 (43)

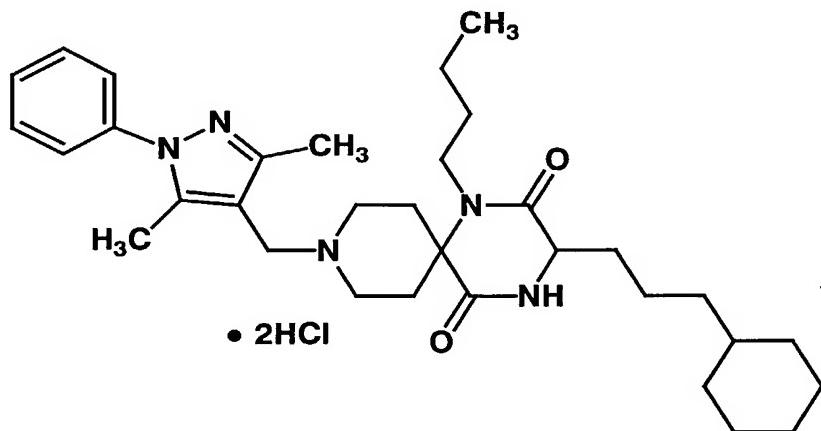
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリルプロピル)-9-
-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
10] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.76 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53-7.49 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H),
 7.10-7.02 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.71 (m,
 1H), 3.56-3.40 (m, 3H), 3.35 (m, 1H), 2.48-2.12 (m, 4H), 1.86-1.10 (m, 19H),
 5 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 24 (44)

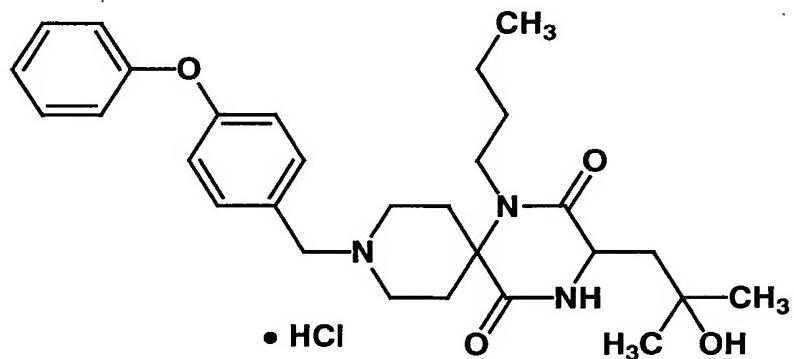
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリルプロピル)-9-
 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
 10 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.45 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.06 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.92
 (m, 1H), 3.77 (m, 1H), 3.63-3.37 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s,
 15 3H), 2.21 (m, 2H), 1.85-1.68 (m, 7H), 1.54 (m, 2H), 1.39 (m, 4H), 1.23 (m, 6H),
 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.89 (m, 2H)。

実施例 24 (45)

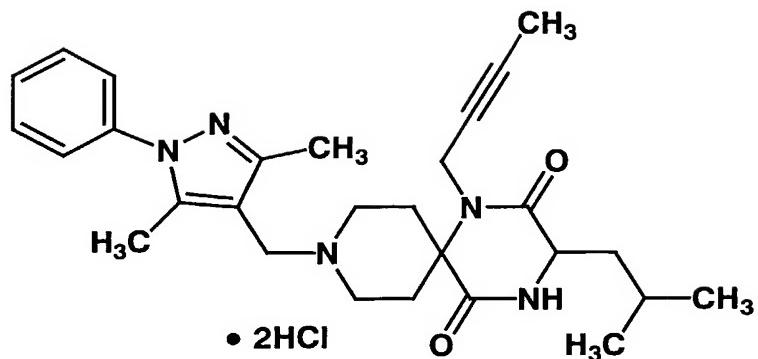
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



5 TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18
 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.32 (brs, 2H), 4.29 (dd, J = 9.9, 3.0 Hz,
 1H), 4.04-3.88 (m, 2H), 3.59-3.40 (m, 4H), 2.46-2.21 (m, 4H), 2.18 (dd, J = 14.4,
 3.0 Hz, 1H), 1.75 (dd, J = 14.4, 9.9 Hz, 1H), 1.61-1.43 (m, 2H), 1.42-1.29 (m, 2H),
 10 1.28 (s, 6H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (4.6)

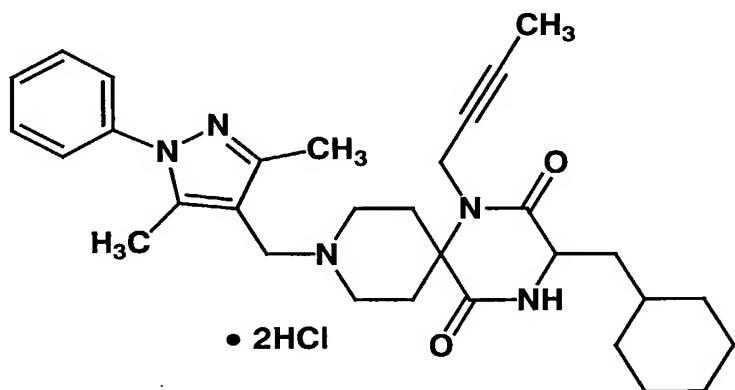
1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.31-4.18 (m, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.77 (m, 2H), 3.68-3.57 (m, 2H), 2.72-2.57 (m, 2H),
 5 2.40 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.92-1.59 (m, 6H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 24 (47)

1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9
 10 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1,
 4, 9 - トリアザスピロ [5, 5] ウンデカン・2 塩酸塩

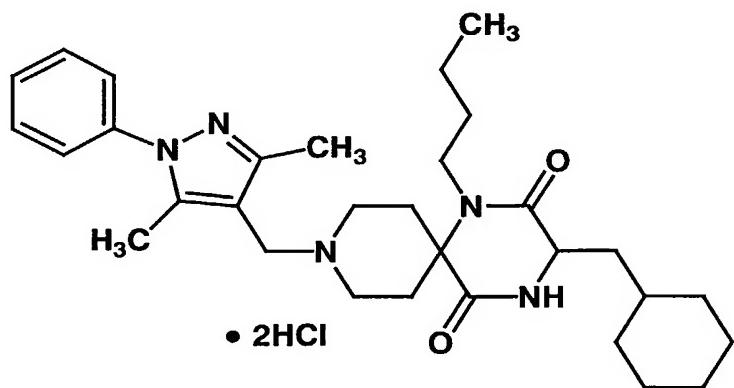


TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : 7.60-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.23 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 4.09

(dd, $J = 7.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.92-3.78 (m, 2H), 3.68-3.56 (m, 2H), 2.66-2.51 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.83-1.60 (m, 10H), 1.59-1.43 (m, 1H), 1.38-1.12 (m, 3H), 1.06-0.87 (m, 2H)。

5 実施例 24 (48)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

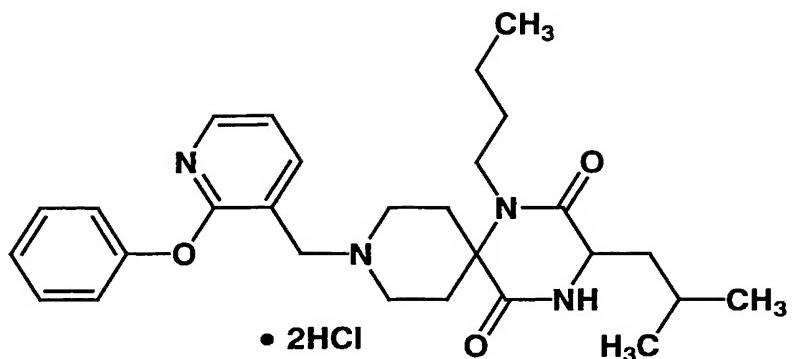


10 TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.63-7.48 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.67-3.56 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30-2.07 (m, 2H), 1.84-1.10 (m, 15 H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

15

実施例 24 (49)

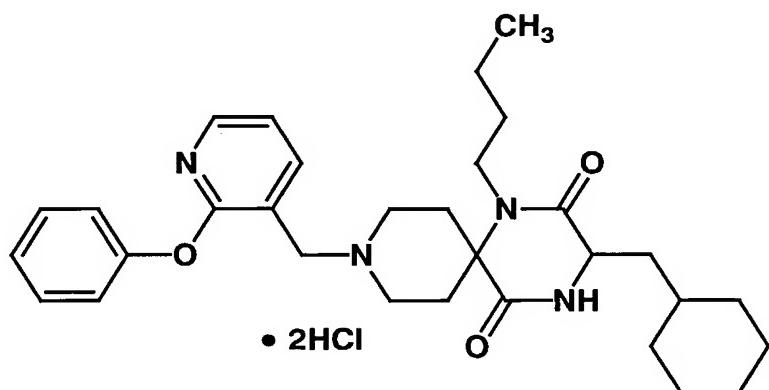
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (m, 1H), 8.07 (m, 1H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.29-7.19 (m, 4H), 4.55 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.54-2.16 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H).

実施例 24 (50)

1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - フ
 10 ェニルオキシピリジン - 3 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5 .
 5] ウンデカン・2塩酸塩

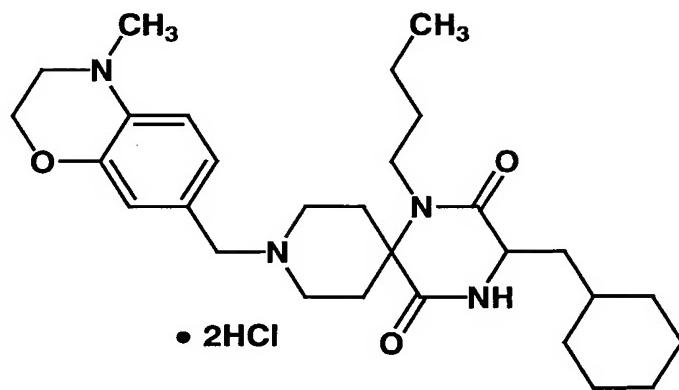


TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (m, 1H), 8.09 (m, 1H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.29-7.19 (m,

4H), 4.55 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.96 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95-0.84 (m, 2H)。

5 実施例 24 (5 1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルベンゾモルホリン-7-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

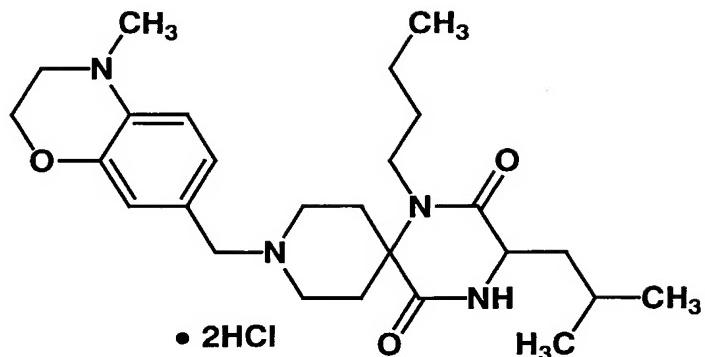


10 TLC : R_f 0.69 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.75 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.28-4.25 (m, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.80-3.65 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 3.40-3.30 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.38-2.06 (m, 4H), 1.78-1.63 (m, 8H), 1.63-1.42 (m, 3H), 1.40-1.18 (m, 6H), 1.05-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。
 15

実施例 24 (5 2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルベンゾモルホリン-7-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

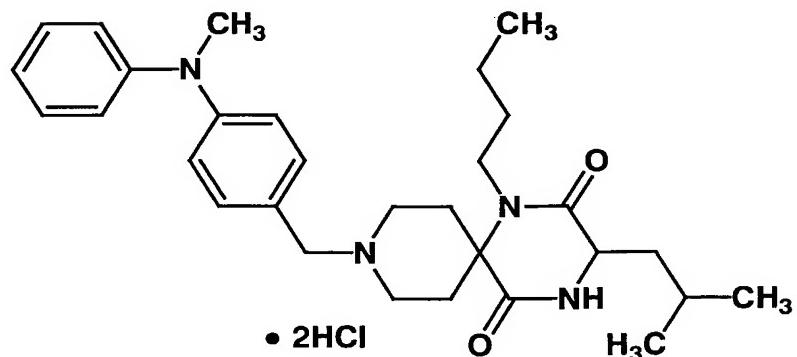


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CDCl_3) : δ 7.00 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.85 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H),
5 4.31-4.29 (m, 2H), 4.19 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.79-3.66 (m, 2H),
3.47-3.34 (m, 6H), 2.97 (s, 3H), 2.45-2.34 (m, 2H), 2.22-2.10 (m, 2H), 1.84-1.75
(m, 1H), 1.71-1.46 (m, 4H), 1.42-1.32 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例24(5.3)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



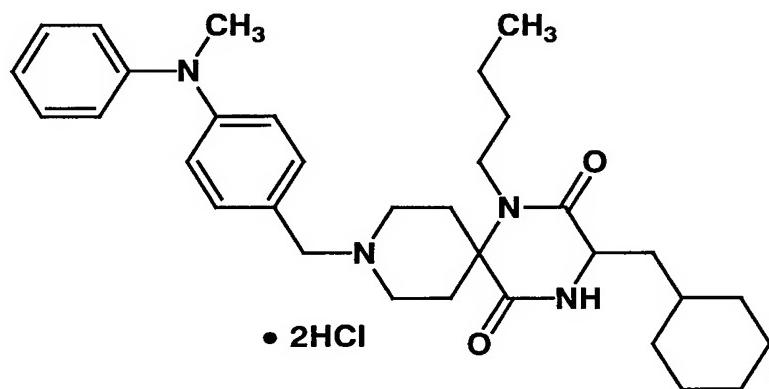
TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 7.19-7.10 (m, 3H), 6.94-6.86 (m, 2H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.86-3.63 (m, 2H), 3.55-3.30 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.46-2.27 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.44-1.26 (m, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

5

実施例 24 (54)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



10

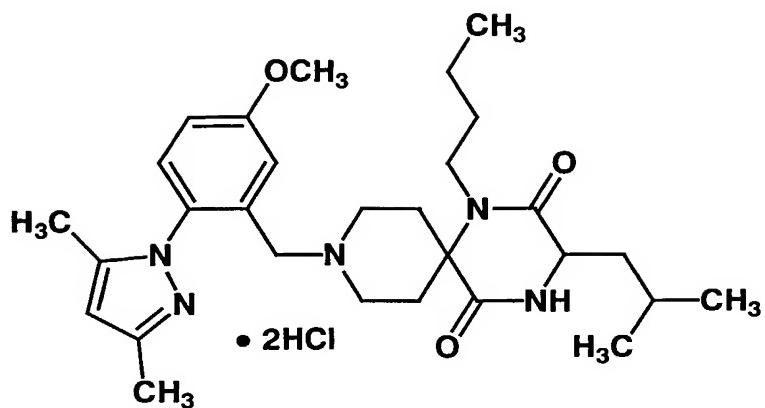
TLC : Rf 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 7.20-7.12 (m, 3H), 6.93-6.86 (m, 2H), 4.24 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.8$ Hz, 1H), 3.85-3.66 (m, 2H), 3.55-3.40 (m, 2H), 3.40-3.30 (m, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.44-2.07 (m, 4H), 1.84-1.40 (m, 10H), 1.40-1.10 (m, 5H), 1.06-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

実施例 24 (55)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)-5-メトキシフェニルメチル)

– 1, 4, 9 – トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

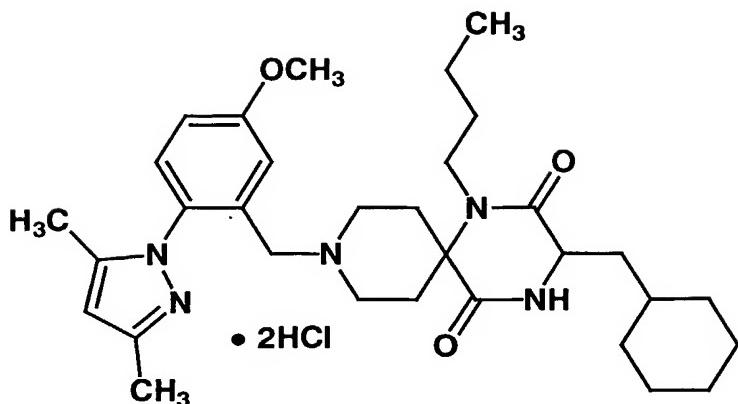


TLC : Rf 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.53 (d, $J = 3.0$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.22 (dd, $J = 8.7, 3.0$ Hz, 1H), 6.29 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 1.86-1.30 (m, 7H), 0.96 (t, $J = 7.8$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

10 実施例 24 (56)

1 – ブチル – 2, 5 – ジオキソ – 3 – シクロヘキシリルメチル – 9 – (2 – (3, 5 – ジメチルピラゾール – 1 – イル) – 5 – メトキシフェニルメチル) – 1, 4, 9 – トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

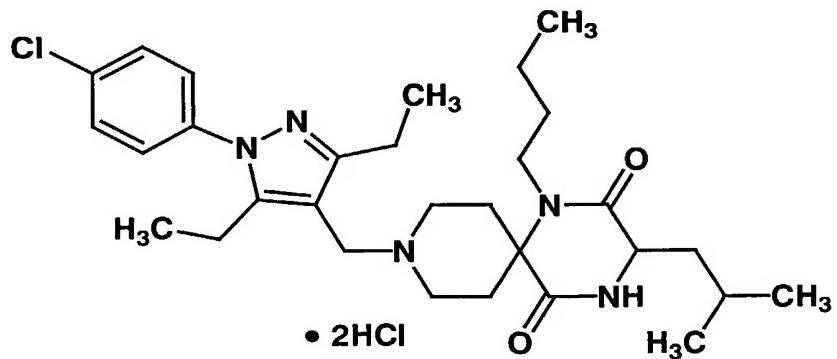


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.80 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (57)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,
10 5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

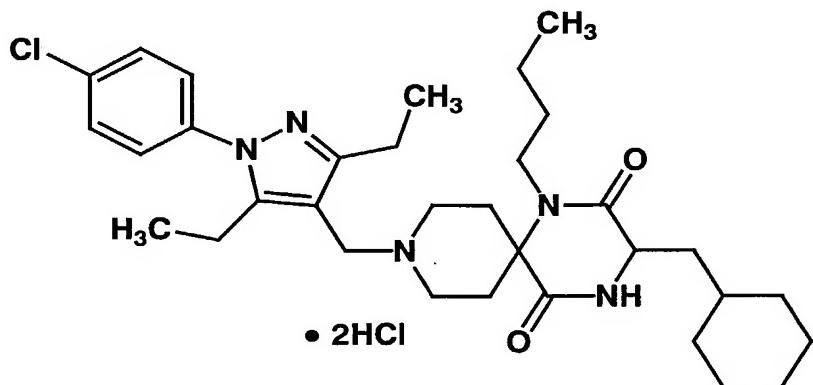
NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s,

2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.65-3.54 (m, 2H), 3.49-3.38 (m, 2H), 2.88 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.77 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 5H), 1.55-1.30 (m, 2H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.99-0.94 (m, 12H)。

5

実施例 24 (58)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



10

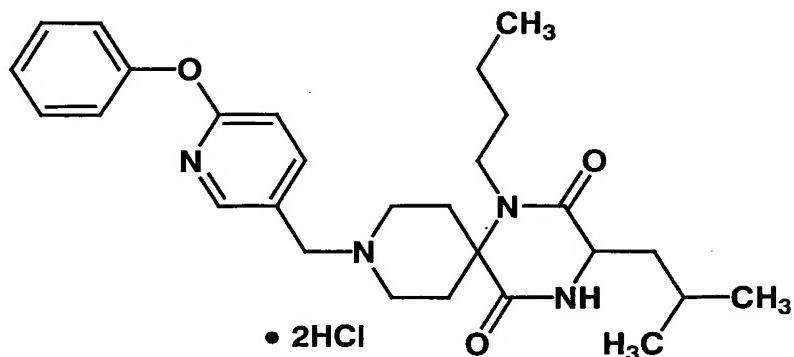
TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.48 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.65-3.54 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 2.88 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.77 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.60-2.40 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.85-1.10 (m, 15H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.04-0.85 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (59)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-

フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ
[5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



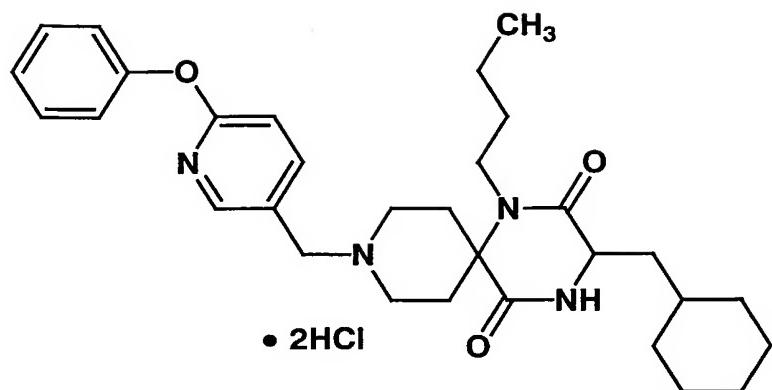
TLC : Rf 0.65 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD_3OD) : δ 8.32 (s, 1H), 8.06 (m, 1H), 7.44 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.26 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.14 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.06 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 4H), 2.45 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.78 (m, 1H), 1.72-1.50 (m, 4H), 1.36 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

10

実施例 24 (60)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2 塩酸塩

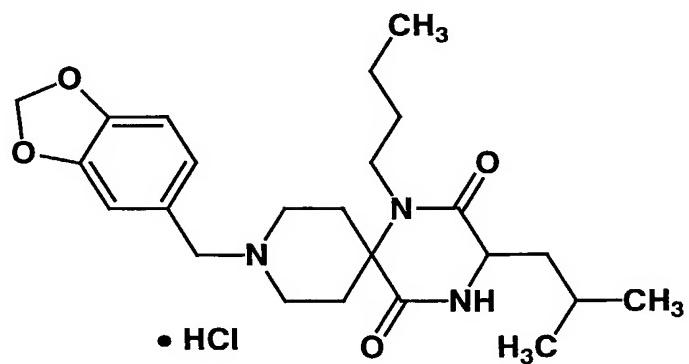


TLC : Rf 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.31 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.5 Hz, 2H),
7.26 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.39 (s,
5 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 3.90-3.76 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.58-
2.36 (m, 2H), 2.25-2.11 (m, 2H), 1.80-1.42 (m, 10H), 1.42-1.17 (m, 5H), 1.05-
0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (61)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1,
3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン・塩酸塩



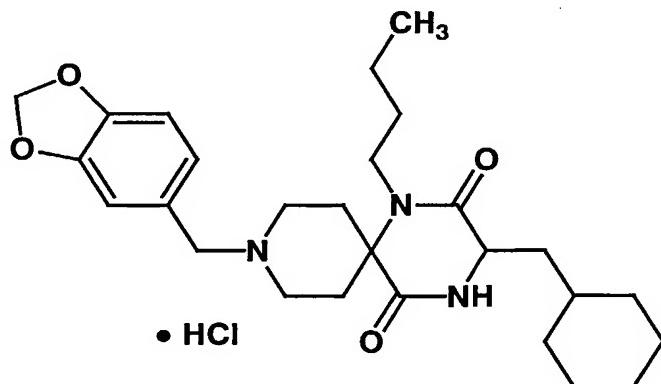
TLC : Rf 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.05-7.00 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.03 (s, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.42-2.10 (m, 4H), 1.88-1.32 (m, 7H), 0.96 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

5

実施例 2 4 (6 2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

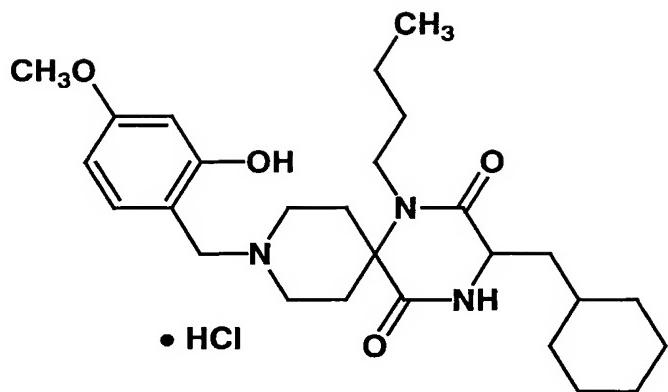
TLC : Rf 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.06-7.01 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.03 (s, 2H), 4.27 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.82-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48-2.10 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

15

実施例 2 4 (6 3)

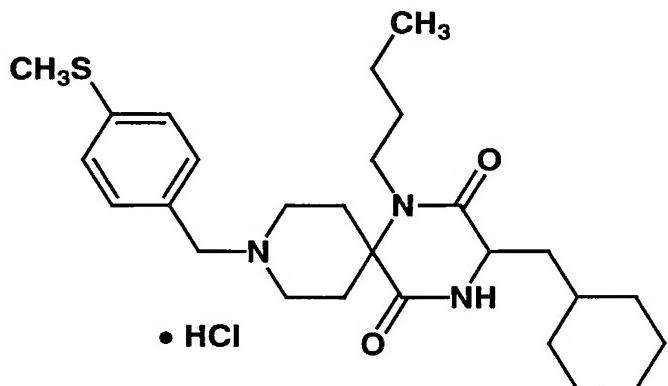
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.88 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.26 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 6.51 (dd, $J = 8.5, 2.5$ Hz, 1H), 6.48
 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 4.26 (s, 2H), 4.03 (m, 1H), 3.77 (m, 5H), 3.47 (m, 2H), 3.37
 5 (m, 2H), 2.34 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.69 (m, 6H), 1.52 (m, 4H), 1.31 (m, 5H),
 0.95 (m, 5H)。

実施例 24 (64)

1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - (4 - メ
 10 チルチオフェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデ
 カン・塩酸塩

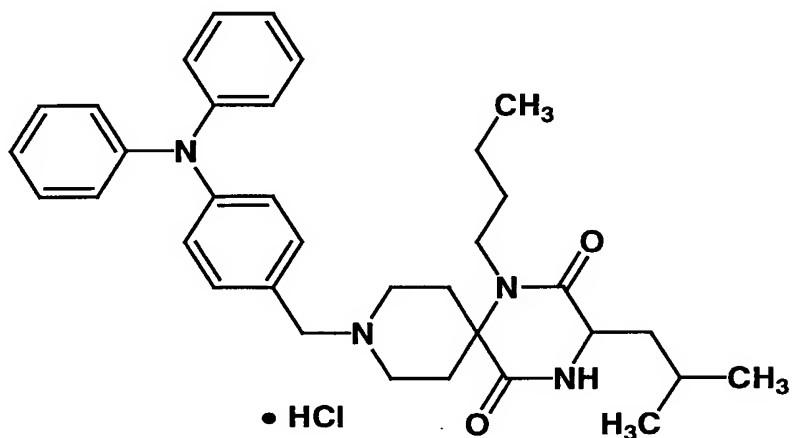


TLC : Rf 0.83 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.44 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.36 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.49 (m, 2H), 3.34 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36-2.11 (m, 4H), 1.69 (m, 10H), 1.39-1.23 (m, 5H), 0.95 (m, 5H)。

5 実施例 24 (65)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



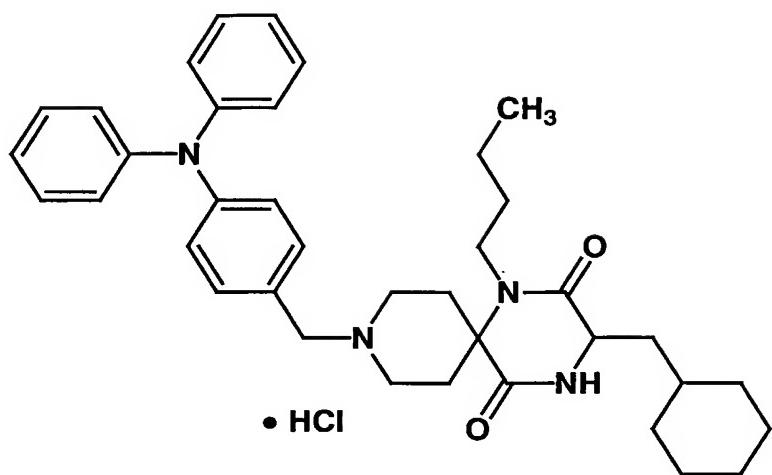
10 TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.40-7.25 (m, 6H), 7.13-7.01 (m, 8H), 4.27 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.87-3.68 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.29-2.10 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

15

実施例 24 (66)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.

5] ウンデカン・塩酸塩



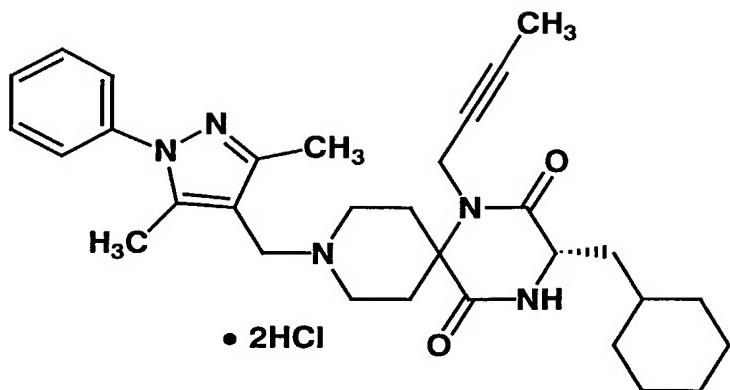
TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41-7.26 (m, 6H), 7.14-7.00 (m, 8H), 4.27 (s, 2H), 4.04 (dd,

5 J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.57-3.45 (m, 2H), 3.44-3.36 (m, 2H),
2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 10H), 1.44-1.14 (m, 5H),
1.00-0.90 (m, 2H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

実施例 24 (67)

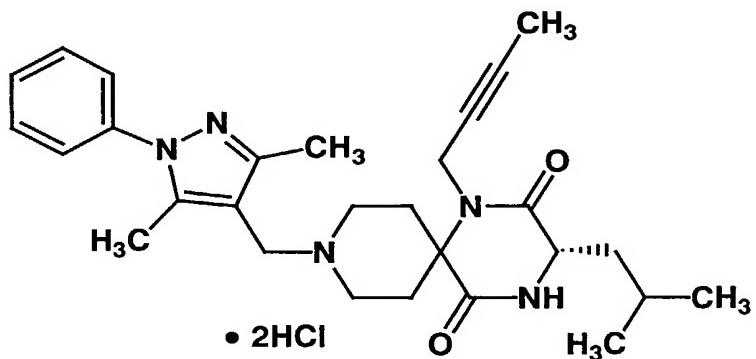
10 (3S)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリ
メチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチ
ル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.24 (s, 2H), 4.09 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.88-1.66 (m, 10H), 1.53 (m, 1H), 1.25 (m, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (68)

(3S)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジメチル-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩
 10

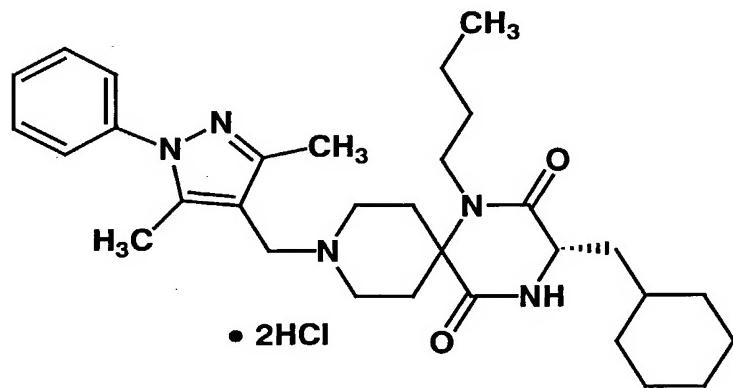


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.26 (m, 2H), 4.06 (dd, J =

7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 1.89-1.61 (m, 6H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

5 実施例 24 (69)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 -(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

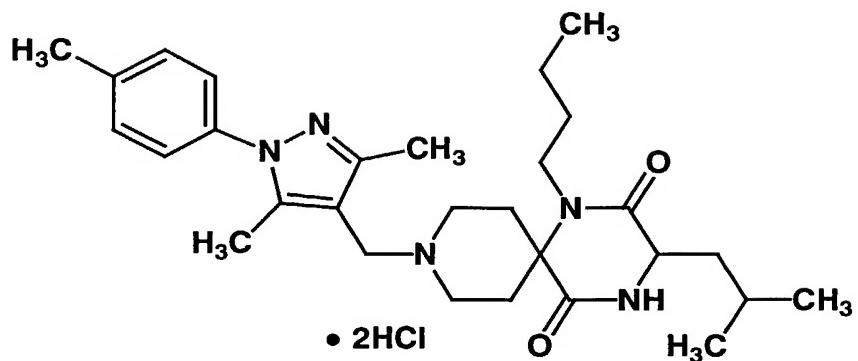


10 TLC : Rf 0.57 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.59-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.53-2.44 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.16 (m, 2H), 1.80-1.17 (m, 15H), 1.02-0.93 (m, 2H), 0.96 (d, J = 7.0 Hz, 3H)。

15

実施例 24 (70)

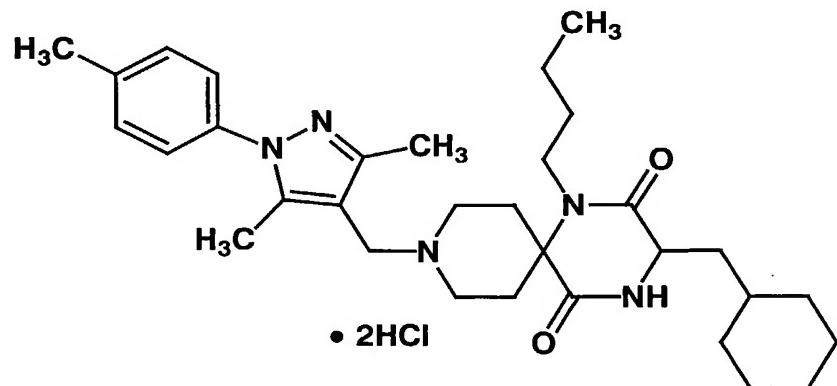
1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,
 5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)
 -1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.36 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.38 (m, 2H),
 5 2.42 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.52-2.18 (m, 4H), 1.90-1.32 (m, 7H),
 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (71)

1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 , 5
 10 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) -
 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩

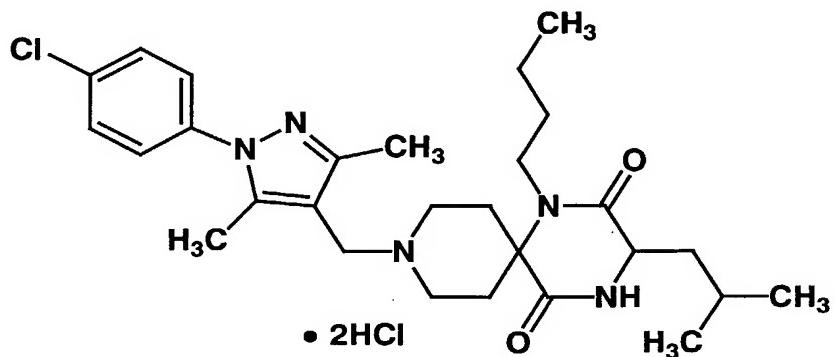


TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s,

2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.56-2.14 (m, 3H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

5 実施例 2 4 (7 2)

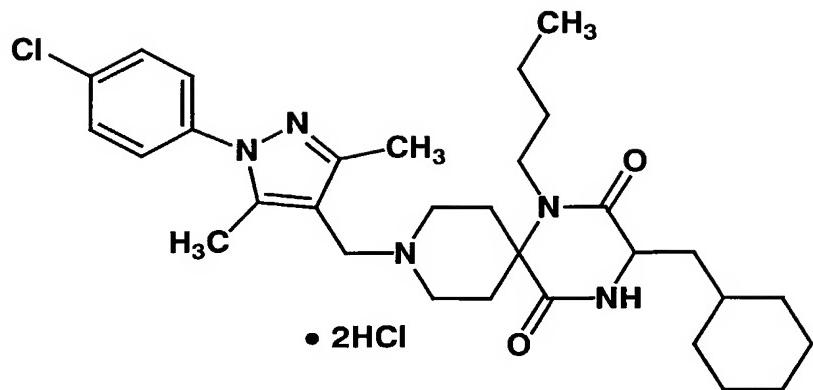
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



10 T L C : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.80 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.46 (m, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.27-2.15 (m, 2H), 1.86-1.81 (m, 1H), 1.76-1.51 (m, 4H), 1.44-1.32 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 3H)。
 15

実施例 2 4 (7 3)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩
 20

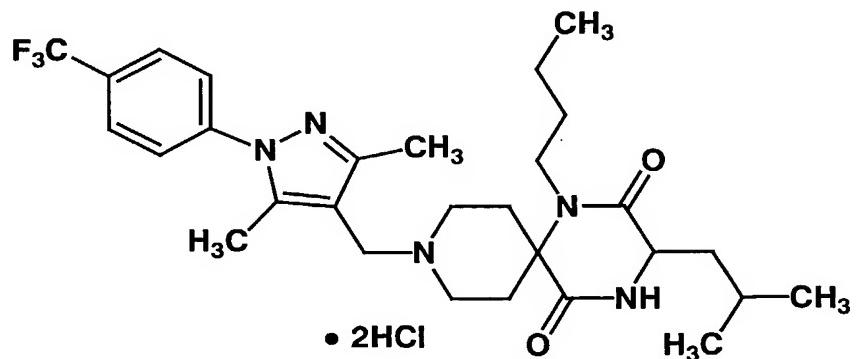


TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.48 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.77 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.39 (s, 6H), 2.27-2.14 (m, 2H), 1.80-1.51 (m, 9H), 1.44-1.17 (m, 6H), 1.03-0.89 (m, 5H)。

実施例 24 (74)

1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,
10 5-ジメチル-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール-4-
イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸
塩

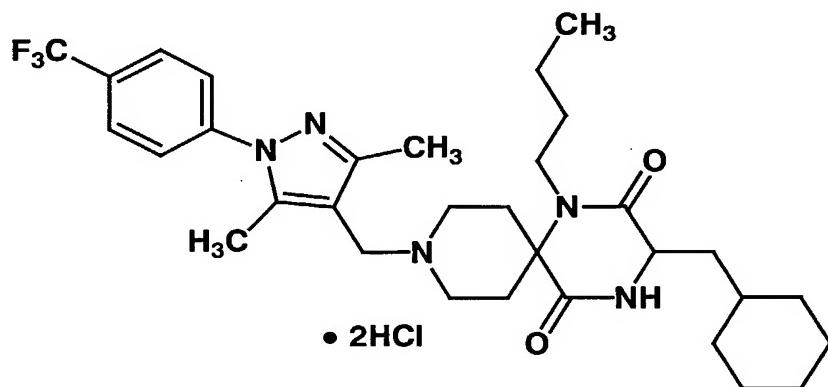


TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.87 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.72 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.93-3.78 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.29-2.16 (m, 2H), 1.86-1.77 (m, 1H), 1.74-1.54 (m, 4H), 1.44-1.34 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.0$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.0$ Hz, 3H)。

実施例 2 4 (7 5)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



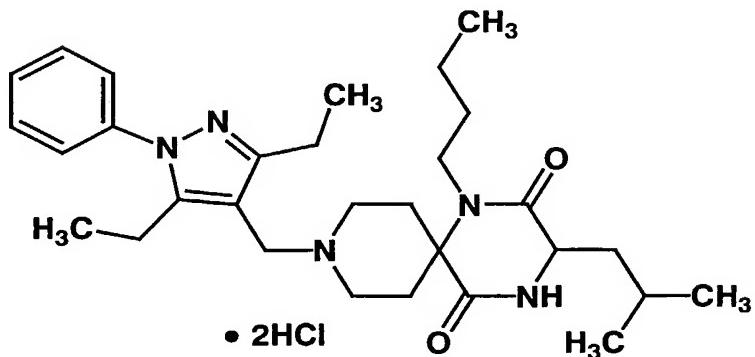
TLC : Rf 0.37 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.87 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.72 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.92-3.78 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.28-2.15 (m, 2H), 1.80-1.51 (m, 9H), 1.44-1.21 (m, 6H), 1.03-0.93 (m, 5H)。

実施例 2 4 (7 6)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,

5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

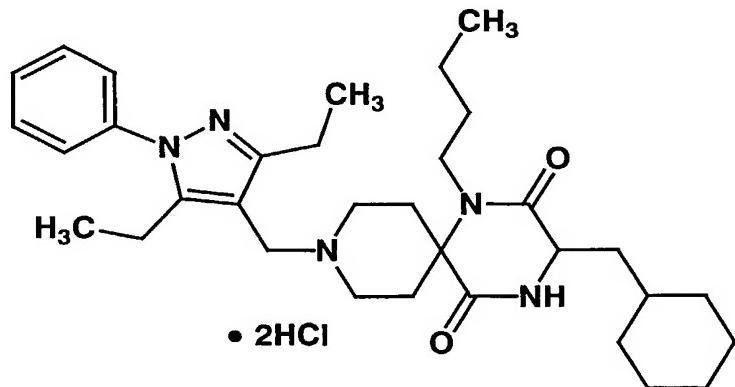


TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.53 (m, 3H), 7.53-7.46 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.79 (m, 2H), 3.65-3.58 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 2.85-2.75 (m, 4H), 2.47 (br, 2H), 2.28-2.16 (m, 2H), 1.83-1.46 (m, 3H), 1.41-1.29 (m, 4H), 0.98-0.91 (m, 15H)。

10 実施例24(77)

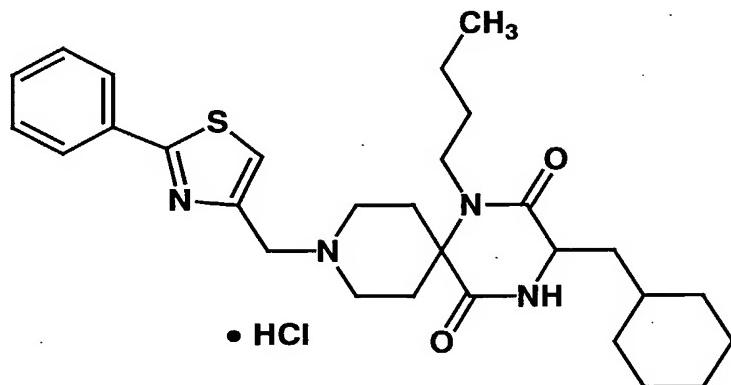
1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(3,5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.53 (m, 3H), 7.53-7.46 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.79 (m, 2H), 3.70-3.55 (m, 2H), 3.47-3.31 (m, 2H), 2.91-2.75 (m, 4H), 2.60-2.45 (m, 2H), 2.30-2.14 (m, 2H), 1.80-1.43 (m, 9H), 5 1.43-1.15 (m, 8H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 24 (78)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 10 5]ウンデカン・塩酸塩

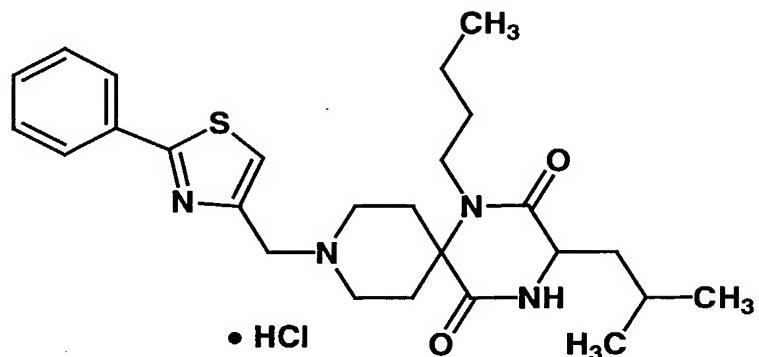


TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.03-8.00 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.52-7.49 (m, 3H), 4.54 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 4.04-3.87 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.51-15 3.39 (m, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.26-2.13 (m, 2H), 1.78-1.43 (m, 9H), 1.40-1.15 (m, 6H), 1.10-0.90 (m, 5H)。

実施例 24 (79)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-

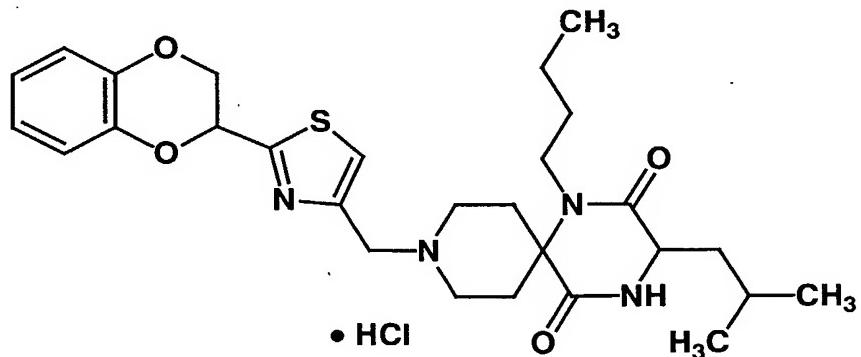
フェニルチアゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 8.02-8.01 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.51-7.50 (m, 3H), 4.55 (s, 2H), 4.03-3.86 (m, 3H), 3.68-3.59 (m, 2H), 3.45-3.36 (m, 2H), 2.50-2.34 (m, 2H), 2.29-2.16 (m, 2H), 1.88-1.45 (m, 5H), 1.36 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

実施例 24 (80)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(1, 4-ベンゾジオキサン-2-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

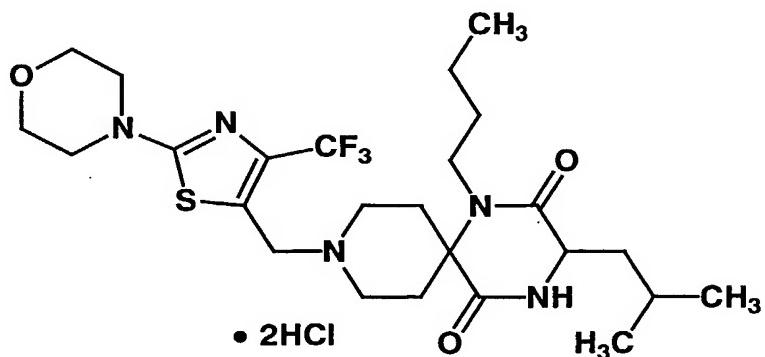


TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.88 (s, 1H), 7.00 (m, 1H), 6.94-6.87 (m, 3H), 5.66 (dd, $J = 6.0, 2.7$ Hz, 1H), 4.62 (dd, $J = 11.7, 2.7$ Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.42 (dd, $J = 11.7, 6.0$ Hz, 1H), 4.02 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.58 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.48-2.16 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

実施例 2 4 (8 1)

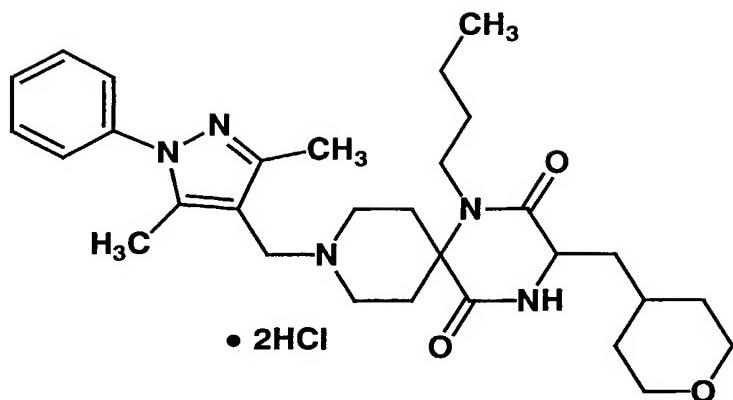
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-トリフルオロメチル-2-(モルホリン-1-イル)チアゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : Rf 0.78 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 4.63 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 6H), 3.58 (m, 6H), 3.40 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 2.22 (m, 2H), 1.88-1.32 (m, 8H), 0.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H)。

実施例 2 4 (8 2)

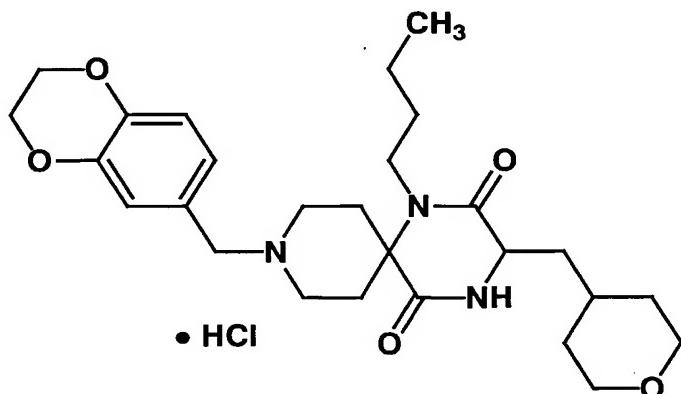
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.46 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.09 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98 - 3.78 (m, 4H), 3.68 - 3.56 (m, 2H), 3.50 - 3.36 (m, 4H), 2.58-2.16 (m, 5H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.84-1.20 (m, 11H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (83)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-10 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

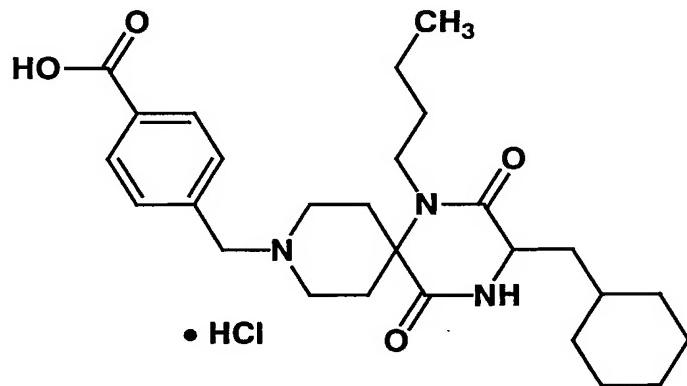


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.92 (m, 3H), 4.27 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.07 (dd, J =

7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 - 3.86 (m, 2H), 3.84 - 3.68 (m, 2H), 3.52 - 3.36 (m, 6H), 2.44-2.10 (m, 4H), 1.82-1.22 (m, 11H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (84)

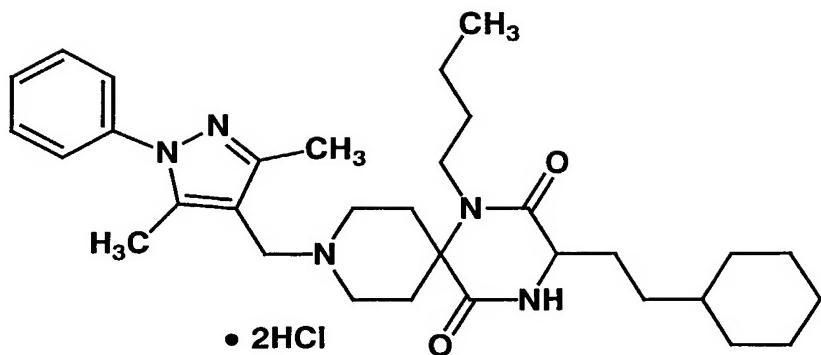
- 5 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-カルボキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



- TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 2 : 1) ;
 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.45 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.76 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.50-2.31 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 1.06-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (85)

- 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシリエチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

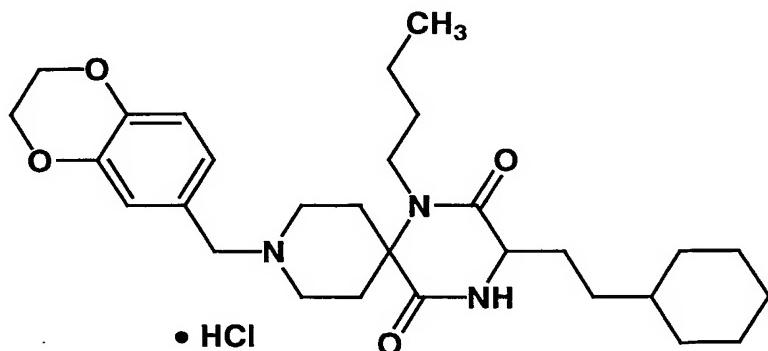


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.56-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (t, J = 4.8 Hz, 1H),
 3.98-3.85 (m, 1H), 3.85-3.70 (m, 1H), 3.65-3.56 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 1H),
 5 3.42-3.30 (m, 1H), 2.55-2.37 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.30-2.13 (m,
 2H), 1.92-1.78 (m, 2H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.60-1.48 (m, 2H), 1.48-1.32 (m, 2H),
 1.32-1.08 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96-0.85 (m, 2H)。

実施例 24 (86)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシリルエチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

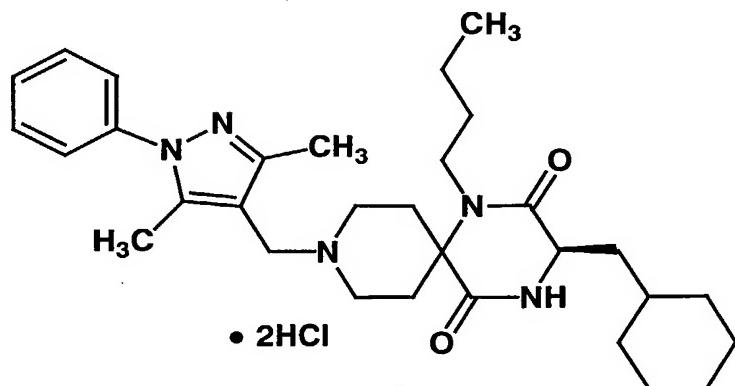
15 NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92

(d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.03 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 3.76-3.62 (m, 1H), 3.50-3.38 (m, 3H), 3.38-3.30 (m, 1H), 2.43-2.06 (m, 4H), 1.92-1.78 (m, 2H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.60-1.45 (m, 2H), 1.42-1.30 (m, 2H), 1.30-1.08 (m, 6H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.97-0.88 (m, 2H)。

5

実施例 24 (87)

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-
 -(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

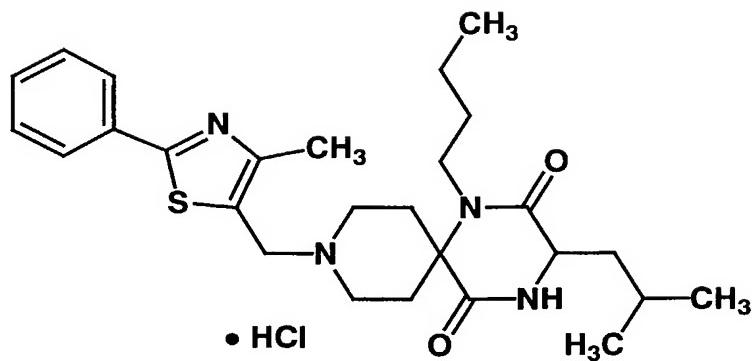
TLC : Rf 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.61-7.48 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.95 - 3.78 (m, 2H), 3.68 - 3.58 (m, 2H), 3.50 - 3.40 (m, 2H), 2.62 - 2.45 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30 - 2.12 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 15H), 0.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

実施例 24 (88)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチル-2-フェニルチアゾール-5-イルメチル)-1,4,9-トリア

ザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

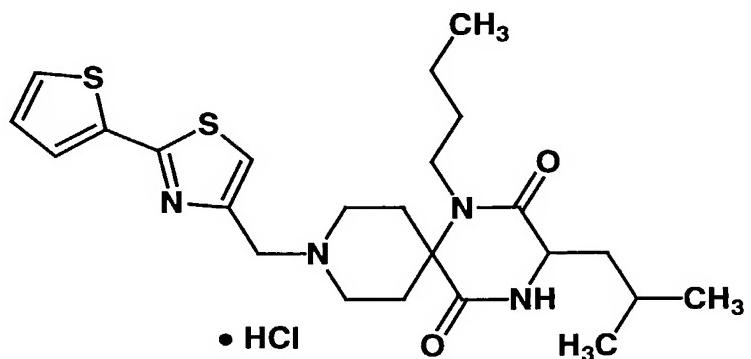


TLC : R_f 0.75 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98-7.95 (m, 2H), 7.55-7.50 (m, 3H), 4.69 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.78 (m, 2H), 3.65-3.56 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.60-2.48 (m, 2H), 2.27-2.14 (m, 2H), 1.88-1.48 (m, 5H), 1.48-1.30 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

実施例 24 (89)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(チオフェン-1-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

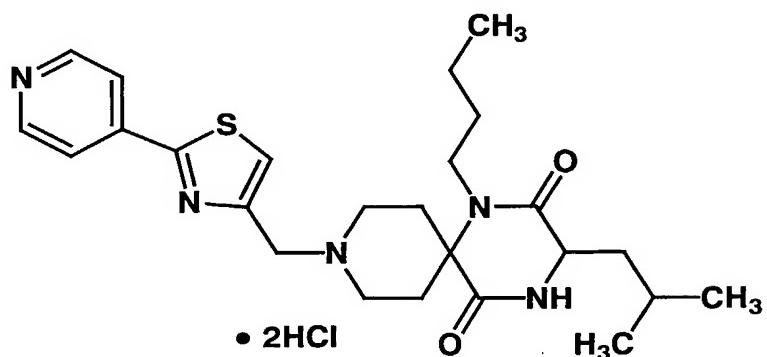
NMR (CD_3OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.67 (d, $J = 3.9$ Hz, 1H), 7.60 (d, $J = 5.4$ Hz, 1H), 7.14 (dd, $J = 5.4, 3.9$ Hz, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.62-3.55 (m, 2H), 3.42 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.86-1.42 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

5

実施例 24 (90)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(ピリジン-4-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

10



15

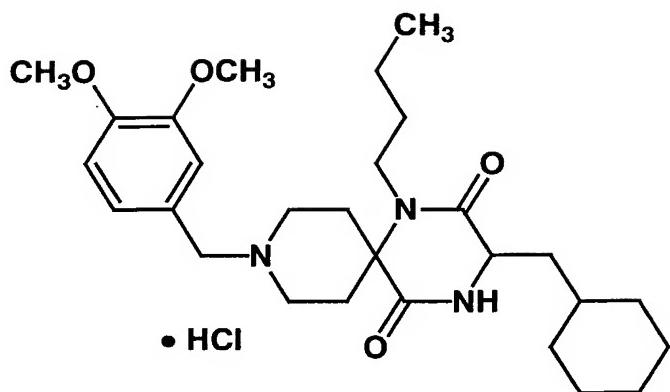
TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.98 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 8.71 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 8.37 (s, 1H), 4.66 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 4.00-3.87 (m, 2H), 3.70-3.59 (m, 2H), 3.50 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.88-1.46 (m, 5H), 1.46-1.35 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

20

実施例 24 (91)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(3, 4-ジメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

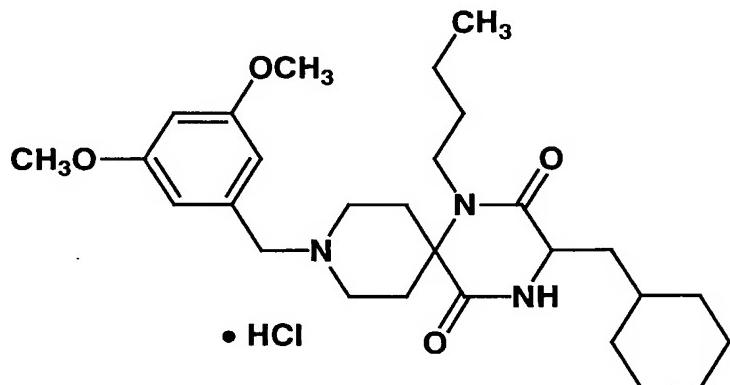


TLC : Rf 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.23 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 4.29 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.8$ Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.88-3.64 (m, 2H), 3.56-3.38 (m, 4H), 2.58-2.37 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (92)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

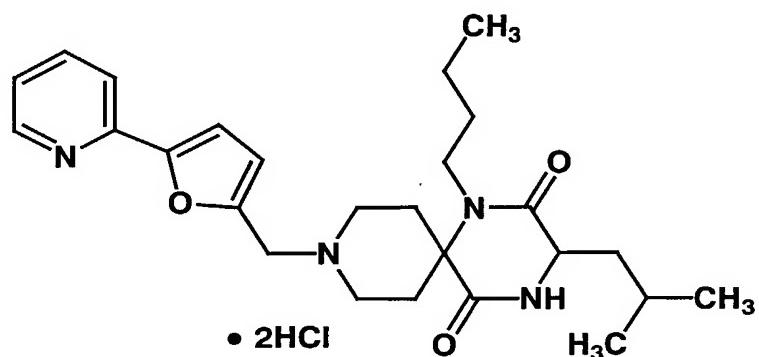
NMR (CD_3OD) : δ 6.74 (d, $J = 1.8$ Hz, 2H), 6.60 (t, $J = 1.8$ Hz, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.83 (s, 6H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H).

5

実施例 24 (93)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-2-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

10



TLC : Rf 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

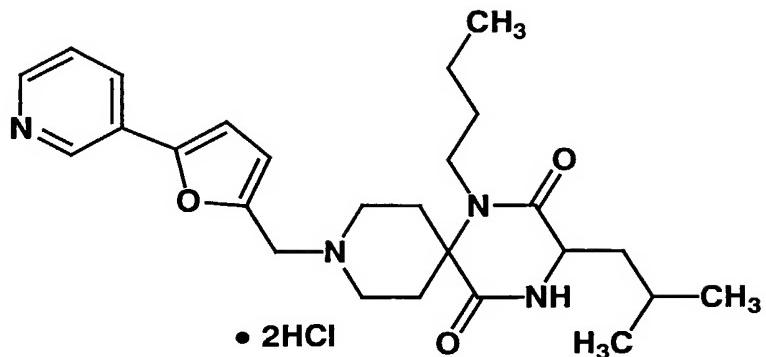
NMR (CD_3OD) : δ 8.76 (dd, $J = 5.4, 1.5$ Hz, 1H), 8.51 (ddd, $J = 8.1, 7.5, 1.5$ Hz, 1H), 8.39 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.85 (dd, $J = 8.1, 5.4$ Hz, 1H), 7.61 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H), 4.63 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.98-3.81 (m, 2H), 3.65-3.55 (m, 2H), 3.49 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 2.72-2.55 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.90-1.27 (m, 7H), 1.00-0.89 (m, 9H)..

実施例 24 (94)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-3-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザ

20

スピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

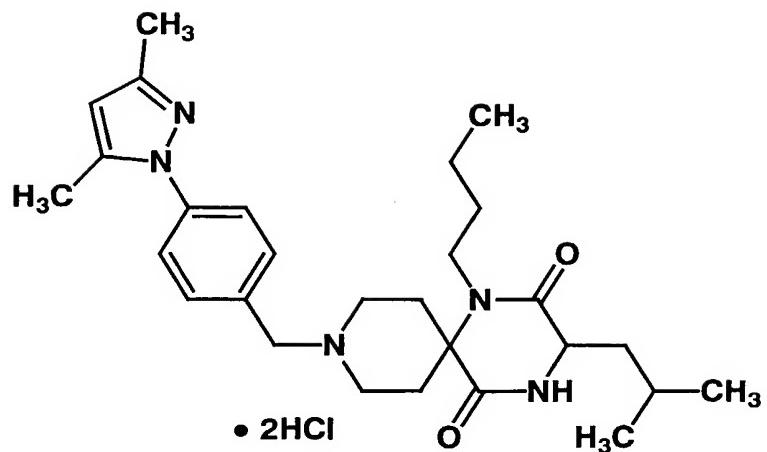


TLC : R_f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.34 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.94 (dd, J = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 8.75
5 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 8.1, 5.4 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.98
(d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.57 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.77 (m, 2H),
3.63-3.43 (m, 4H), 2.73-2.55 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.89-1.27 (m, 7H),
1.00-0.89 (m, 9H)。

10 実施例 24 (95)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2 塩酸塩

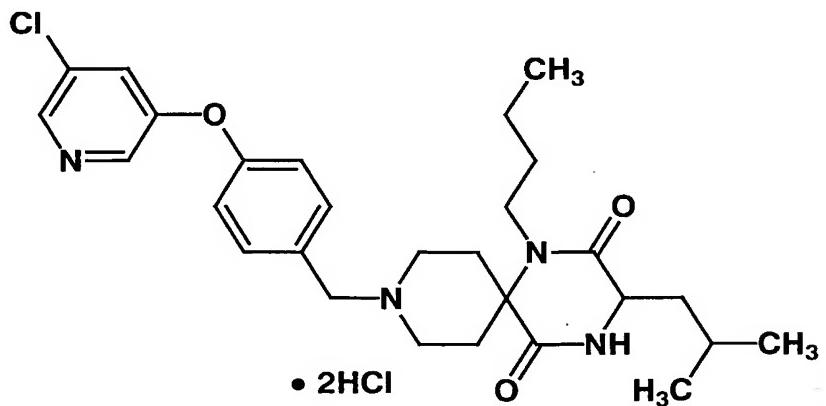


TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.94 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.51 (s, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.76 (m, 2H), 3.58-3.48 (m, 4H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.88-1.45 (m, 5H), 1.45-1.34 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (96)

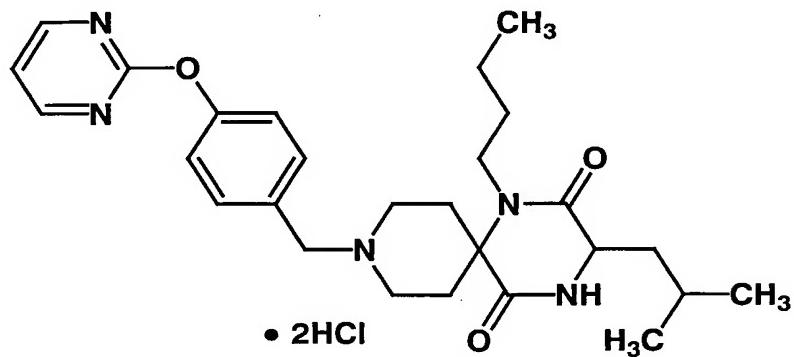
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(5-クロロピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.54 (bs, 1H), 8.45 (bs, 1H), 7.87 (bs, 1H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.73 (m, 2H), 3.56-3.40 (m, 4H), 2.64-2.46 (m, 2H), 2.24-2.09 (m, 2H),
 5 1.86-1.42 (m, 5H), 1.42-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (97)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 10 スピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

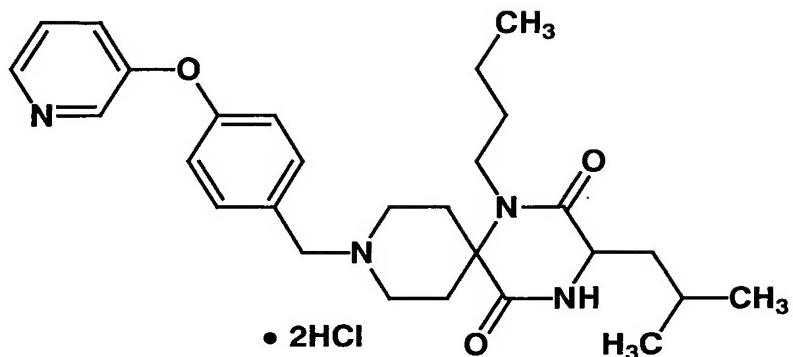


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.62 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 15 3.93-3.72 (m, 2H), 3.60-3.35 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H),
 1.90-1.45 (m, 5H), 1.45-1.36 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 24 (98)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザス

ピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

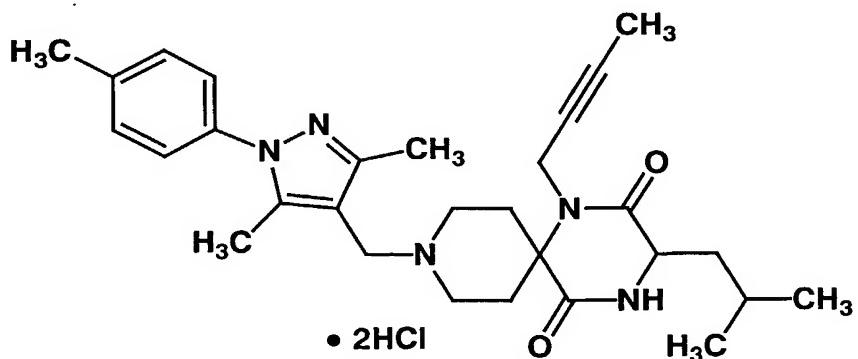


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.76 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 8.07 (dd, J = 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.72 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.68-2.48 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

10 実施例24(99)

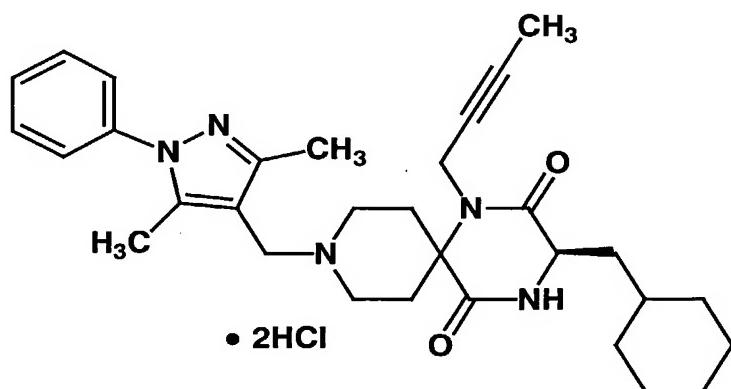
1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.29 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.27-4.20 (m, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 2.59 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.92-1.60 (m, 6H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 5 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (100)

(3R)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩
 10

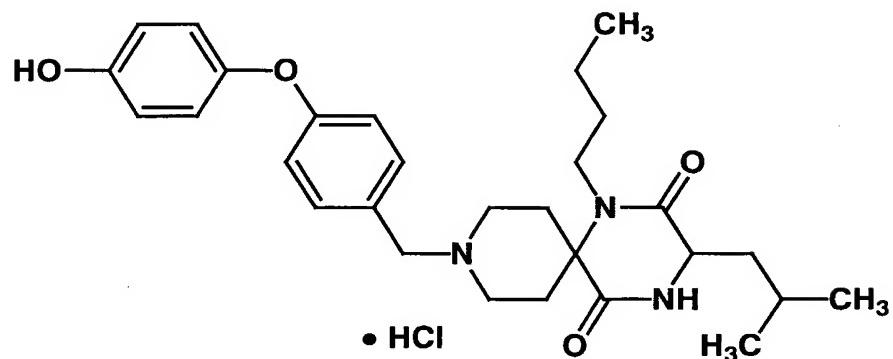


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.43 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.25 (q, J = 2.1 Hz, 2H), 4.09 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.85 (dt, J = 3.0, 12.3 Hz, 2H), 3.68-3.56 (m, 2H), 2.61 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.83-1.43 (m, 8H), 1.75 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.38-1.12 (m, 3H), 0.96 (m, 2H)。
 15

実施例 24 (101)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-

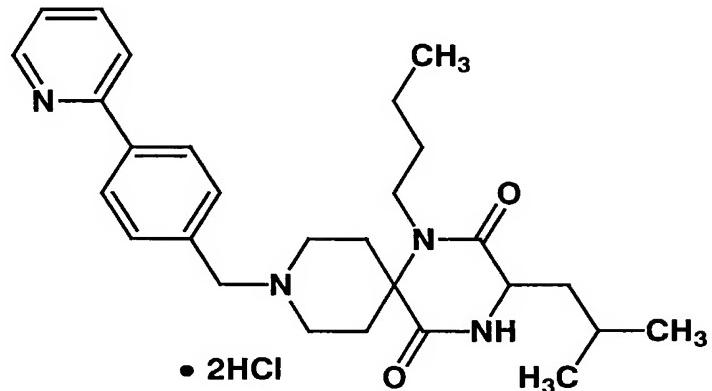
(4-ヒドロキシフェニルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.97 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.88-1.44 (m, 5H), 1.44-1.28 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

10 実施例 24 (102)

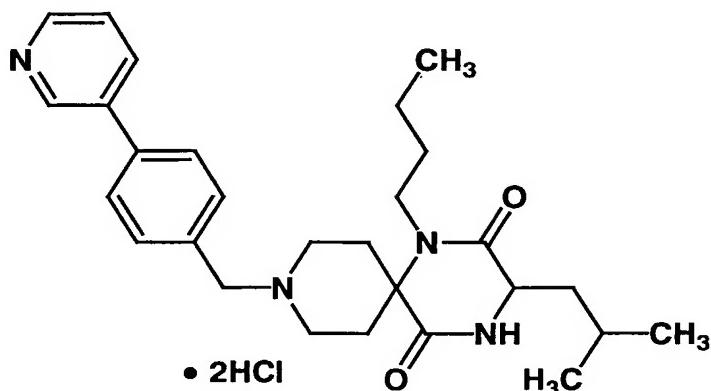
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.89 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.70 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.10-8.06 (m, 3H), 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.51 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.56-3.45 (m, 4H), 2.72-2.58 (m, 2H),
 5 2.24-2.08 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 5H), 1.44-1.34 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (103)

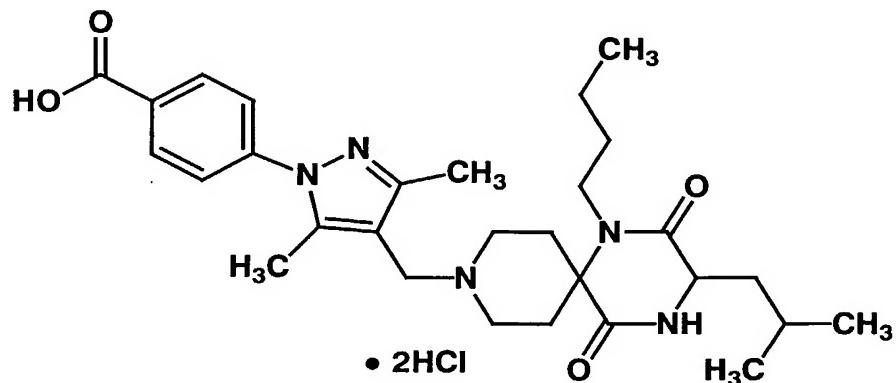
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.10.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.24 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 8.4, 5.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.75 (m, 2H), 3.58-3.44 (m, 4H), 2.64-2.50 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.88-1.48 (m, 5H), 1.48-1.32 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (104)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

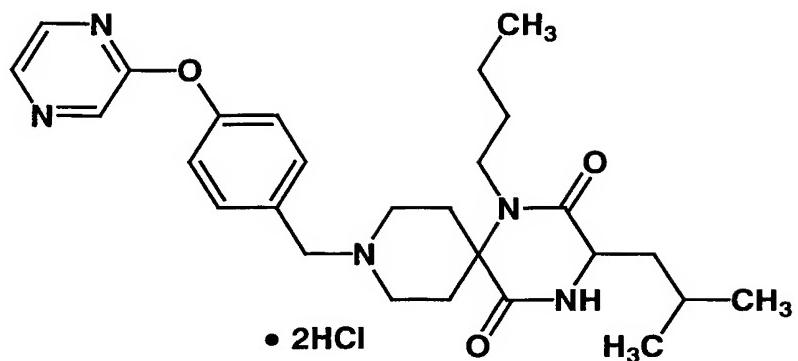


5 TLC : R_f 0.27 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 9H)。

10

実施例24(105)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピラジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

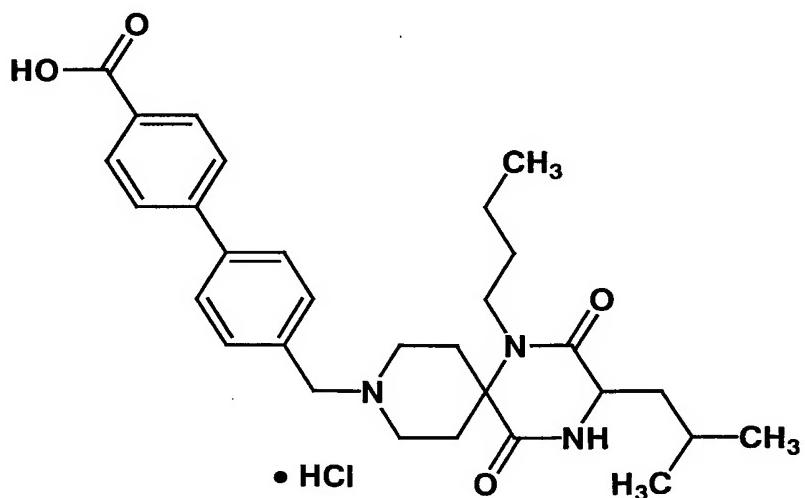


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.47 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.13 (dd, J = 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.58-3.46 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.52-2.34 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.26 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H).

実施例 24 (106)

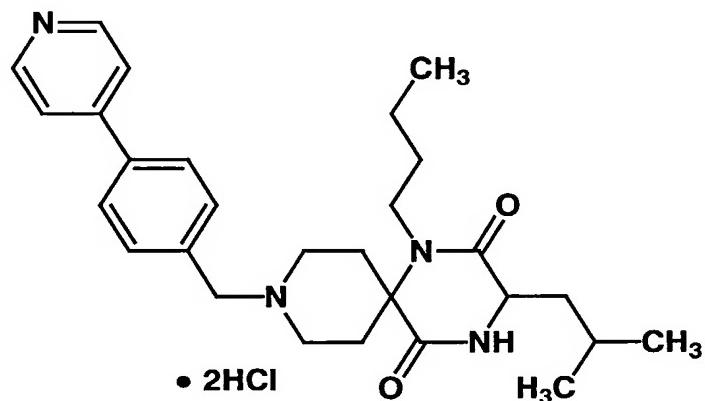
- 10 1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.11 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.83 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.55-2.38 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H),
 5 1.88-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (107)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-4-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.10.5]ウンデカン・2塩酸塩

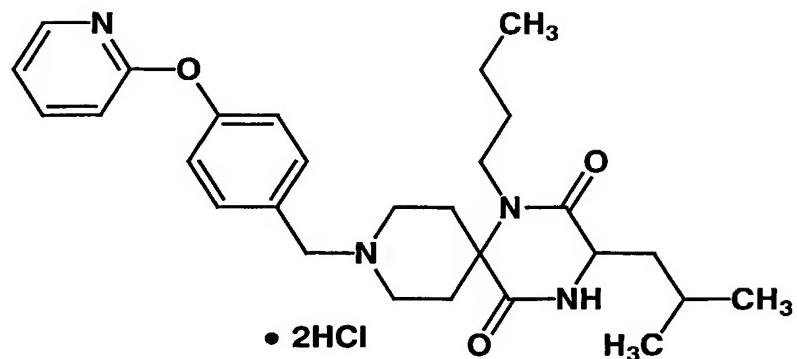


TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.91 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.45 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.11 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.91 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.64-2.48 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H),
 15 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 - 0.93 (m, 9H)。

実施例 24 (108)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-

(ピリジン-2-イルオキシ) フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

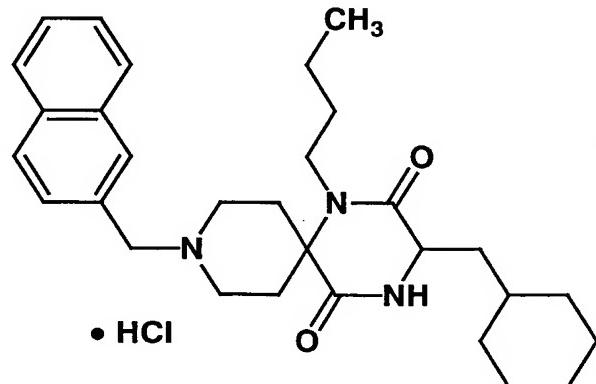


TLC : Rf 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD_3OD) : δ 8.44-8.15 (m, 2H), 7.82 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 7.60-7.40 (m, 1H), 7.42 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 7.27-7.24 (m, 1H), 4.43 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.5$, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.64-2.42 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.92-1.28 (m, 7H), 0.97 - 0.94 (m, 9H)。

10 実施例24 (109)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ナフタレン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

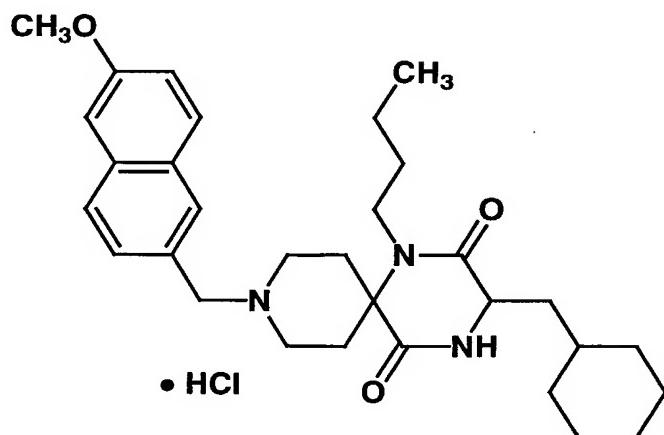


TLC : R_f 0.71 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.08-7.93 (m, 4H), 7.64-7.57 (m, 3H), 4.54 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.80 (m, 2H), 3.60-3.44 (m, 2H), 3.42-3.36 (m, 2H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 24 (110)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

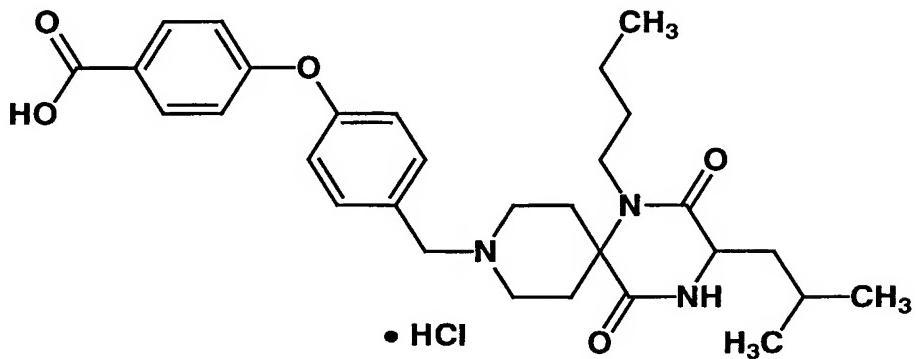


10

TLC : R_f 0.75 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (s, 1H), 7.91 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.48 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.94-3.78 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.58-3.44 (m, 2H), 3.42-3.36 (m, 2H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 24 (111)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

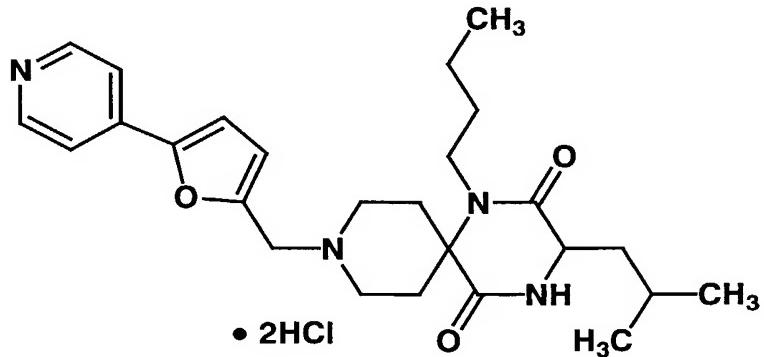


5. TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.25-2.10 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 5H), 1.44-1.39 (m, 2H), 0.98-0.93 (m, 9H)。

10

実施例 24 (112)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-4-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

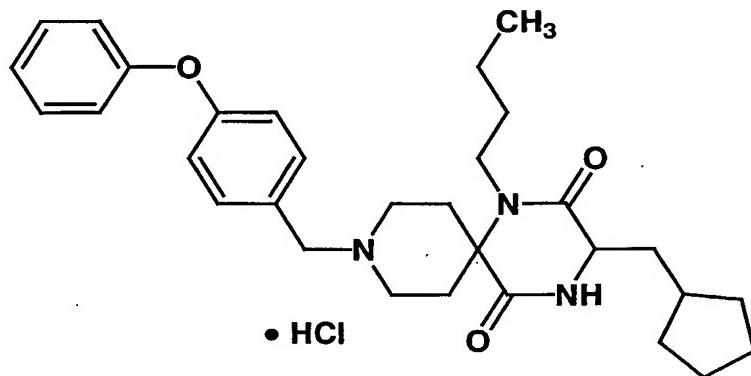


15

TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.80 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.39 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.62 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5, Hz, 1H), 3.99-3.79 (m, 2H), 3.65-3.43 (m, 4H), 2.72-2.54 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 5H), 1.88-1.26 (m, 7H), 1.00-0.84 (m, 9H)。

実施例 24 (113)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

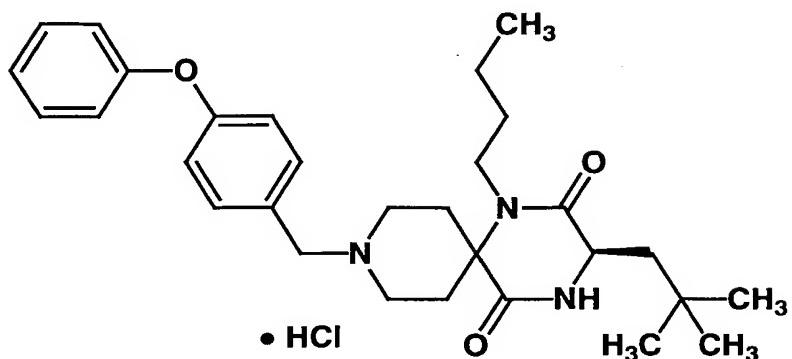


TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.05 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.49 (m, 2H), 3.39 (m, 2H), 2.37 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.96 (m, 1H), 1.81 (m, 4H), 1.58 (m, 6H), 1.38 (m, 2H), 1.17 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (114)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピ

ル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



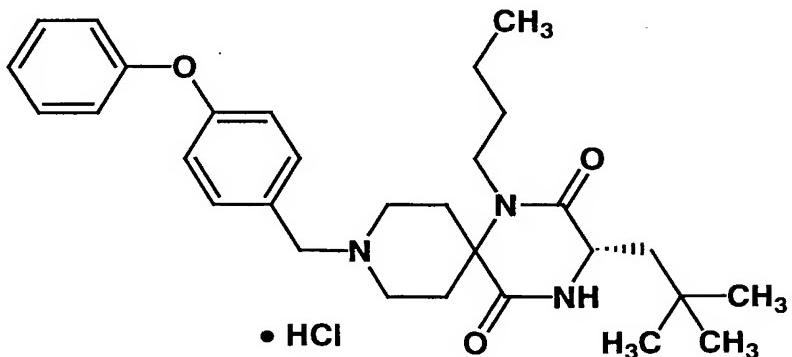
TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.2, 3.3 Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.71 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.00 (dd, J = 14.0, 3.3 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.2 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

10

実施例 24 (115)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2, 2 - ジメチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

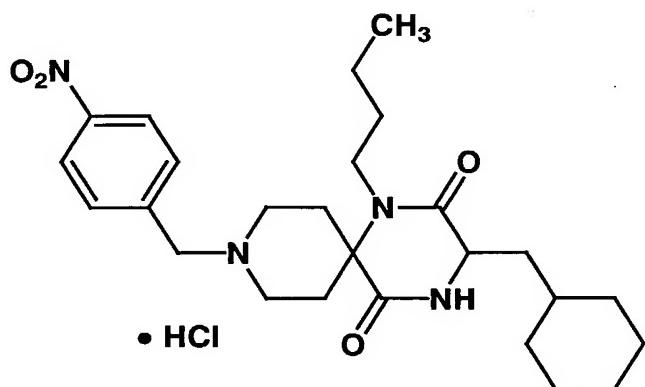


15

TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.2, 3.3 Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.71 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.00 (dd, J = 14.0, 3.3 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.2 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (116)

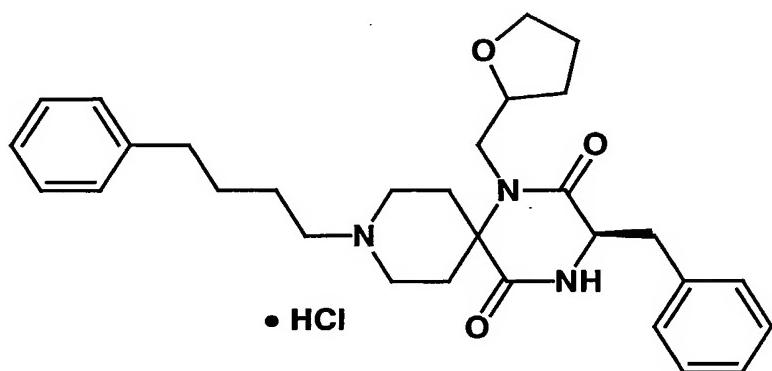
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-二
10 トロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・
塩酸塩



TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.33 (d, J=8.7Hz, 2H), 7.78 (d, J=8.7Hz, 2H), 4.49 (s, 2H),
 15 4.03 (dd, J=7.5, 4.5Hz, 1H), 3.93-3.76 (m, 2H), 3.55-3.43 (m, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.45-2.28 (m, 2H), 2.27-2.08 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 24 (117)

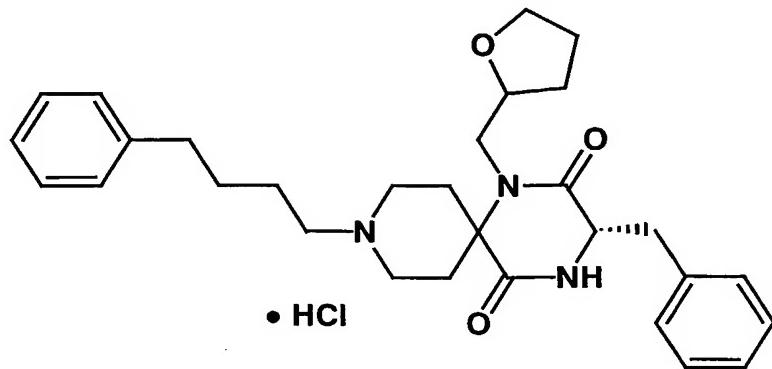
(3R) - 1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



5 TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.38-7.14 (m, 10H), 6.00 - 5.75 (m, 1H), 4.40-4.15 (m, 2H),
 3.92-3.58 (m, 3H), 3.58-2.25 (m, 13H), 2.18-1.45 (m, 10H)。

実施例24 (118)

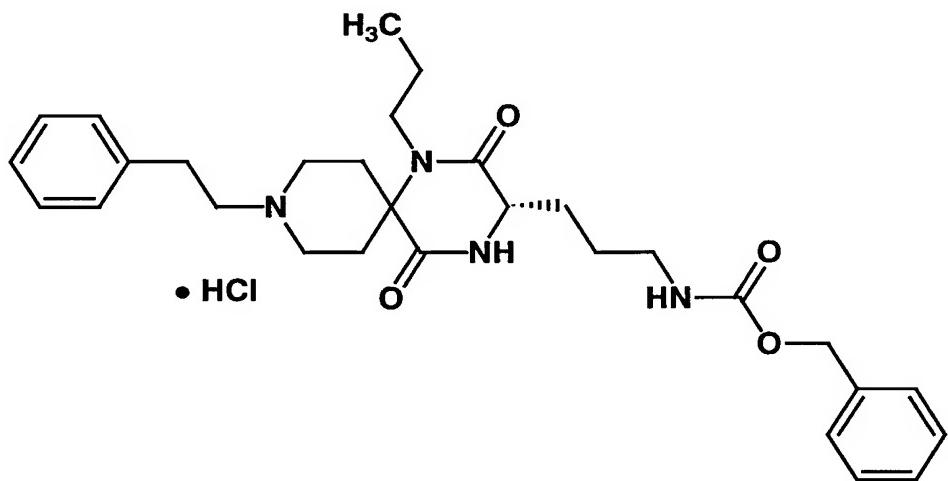
10 (3S) - 1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.40-7.15 (m, 10 H), 6.05 - 5.80 (m, 1H), 4.40-4.10 (m, 2 H),
 3.90-3.55 (m, 3 H), 3.55-2.20 (m, 13 H), 2.18-1.45 (m, 10 H)。

5 実施例 24 (119)

(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



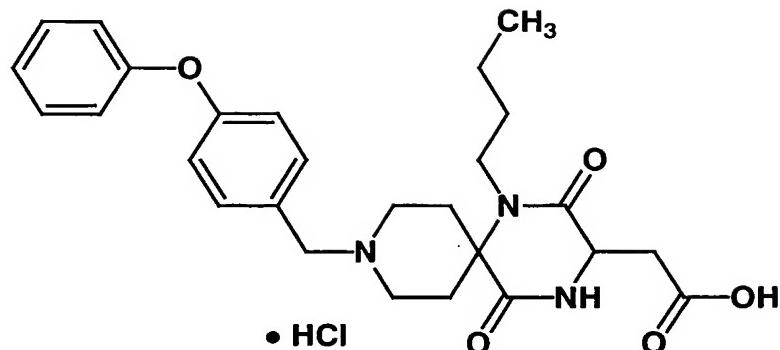
10 TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.20 (m, 10 H), 5.06 (s, 2 H), 4.09 (dd, J = 5.2, 4.6 Hz,
 1 H), 4.00 - 3.70 (m, 2 H), 3.70 - 3.55 (m, 2 H), 3.50 - 3.30 (m, 4 H), 3.20 - 3.00
 (m, 4 H), 2.65 - 2.35 (m, 2 H), 2.30 - 2.10 (m, 2 H), 2.00 - 1.75 (m, 2 H), 1.70 -
 1.40 (m, 4 H), 0.96 (t, J = 7.4 Hz, 3 H)。

15

実施例 25

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(カルボキシメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウ

ンデカン・塩酸塩



実施例 24 (11) で製造した化合物 (173 mg) のメタノール (5 mL) 溶液に、2 N 水酸化ナトリウム水溶液 (2 mL) を加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に 2 N 塩酸水溶液を pH が 4 になるまで加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。得られた残渣を 1, 4-ジオキサンに溶解し、4 N 塩酸・1, 4-ジオキサン溶液を加えた。反応混合物を濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の物性値を有する本発明化合物 (127 mg) を得た。

TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 4 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : 7.55-7.53 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.20-7.15 (m, 1H),
 7.07-7.02 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.27 (t, J = 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.90 (m, 1H), 3.72-
 3.66 (m, 1H), 3.54-3.38 (m, 4H), 2.97 (dd, J = 18.0, 4.8 Hz, 1H), 2.79 (dd, J =
 15 18.0, 4.8 Hz, 1H), 2.50-2.36 (m, 3H), 2.27-2.16 (m, 1H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.41-
 1.30 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

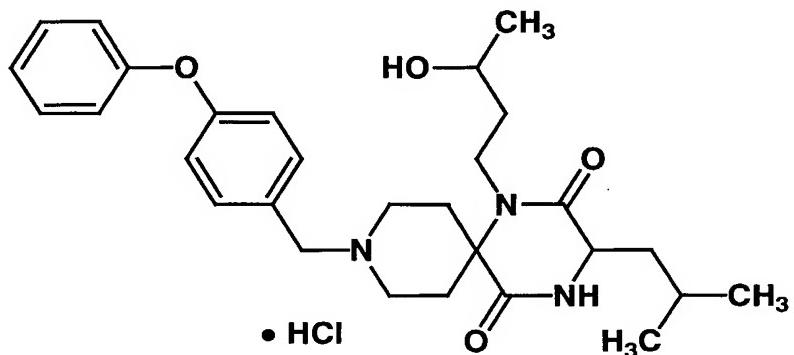
実施例 26 (1) ~ 26 (3)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル -4-ピペリドンを用いて、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカ

ルボニル) ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3 →参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-ホルミルピラゾールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 5 →参考例 6 →実施例 1 と同様の操作をし、さらに、水酸基が一部アセチル化されたために、実施例 2 5 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

実施例 2 6 (1)

1 - (3 - ヒドロキシブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

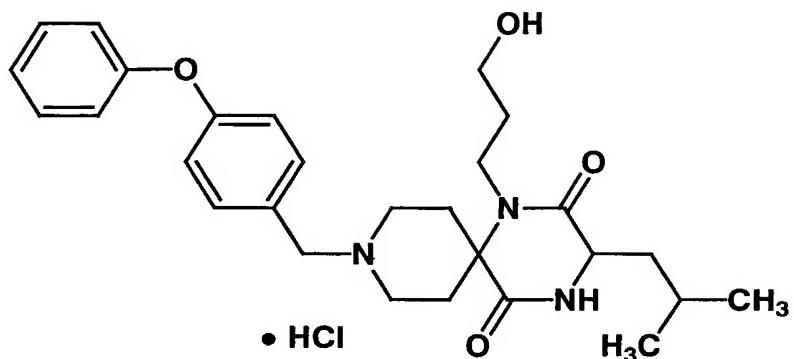


TLC : Rf 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.02 (m, 1H), 3.80 (m, 3H), 3.51 (m, 4H), 2.46 (m, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.85-1.57 (m, 5H), 1.17 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 9.0 Hz, 6H)。

実施例 2 6 (2)

1 - (3 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリア

アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

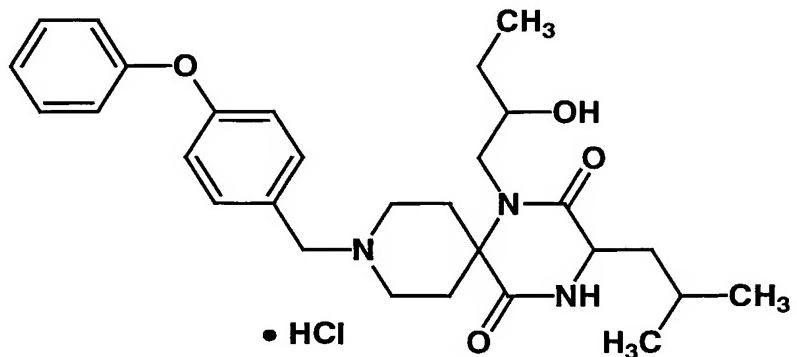


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.0 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.60 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.48 (m, 4H), 2.40 (m, 2H), 2.20 (m, 2H), 1.82-1.58 (m, 5H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.0 Hz, 3H)。

実施例 2 6 (3)

10 1-(2-ヒドロキシブチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



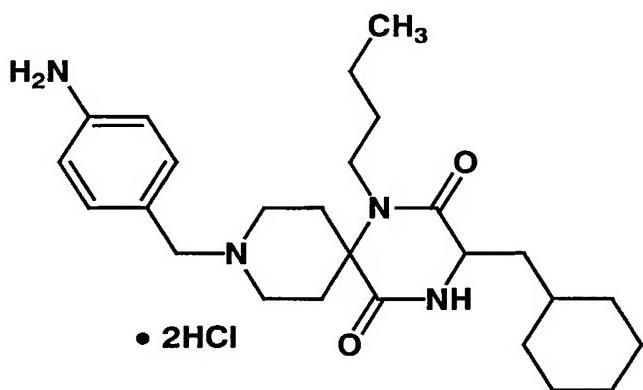
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.50 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (dd, $J = 8.7, 7.5$ Hz, 2H), 7.18 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 8.1, 4.8$ Hz, 1H), 3.96-3.41 (m, 6H), 3.27-3.14 (m, 1H), 2.68-2.53 (m, 1H), 2.37-2.26 (m, 3H), 1.94-1.24 (m, 5H), 1.08-0.82 (m, 9H)。

5

実施例 2 7

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-アミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2 塩酸塩



10

実施例 2 4 (116) で製造した化合物 (50 mg) のメタノール溶液にアルゴン雰囲気下、5 % パラジウム-炭素 (10 mg) を加えた。反応混合物を水素ガス雰囲気下、室温で 20 分間攪拌した。反応混合物をセライト (商品名) を通して、ろ過し、ろ液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 50 : 1 → 30 : 1 → 20 : 1) によって精製した。得られた化合物をメタノールに溶解し、4 N 塩酸/酢酸エチル溶液を加え、濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の物性値を有する本発明化合物 (34 mg) を得た。

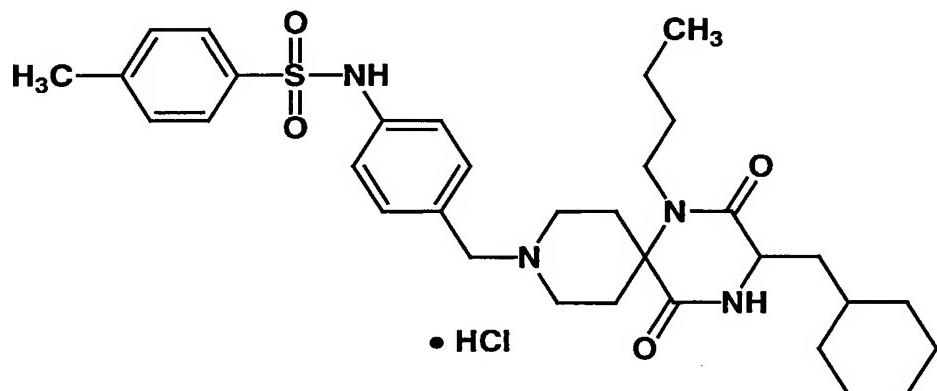
TLC : R_f 0.21 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.80 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.47 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.86-3.74 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 4H), 2.65-2.52 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.94 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.94 (m, 2H)。

5

実施例 2 8

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-((4-(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



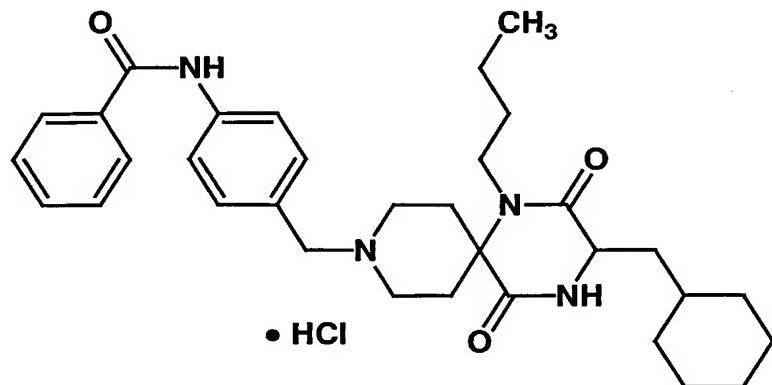
10

実施例 2 8 で製造した化合物 (3.3 mg) のピリジン (2 ml) 溶液に、
p-トルエンスルホニルクロライド (2.1 mg) を加えた。反応混合物を室
温で 27 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶
液を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗
15 清し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムク
ロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) によって精製し
た。得られた化合物をメタノールに溶解し、4 N 塩酸／酢酸エチル溶液を加
え、濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の
物性値を有する本発明化合物 (2.7 mg) を得た。

TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.5 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.42-2.06 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 1.82-1.10 (m, 15H),
 5 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 28 (1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(フェニルカルボニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
 10 [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

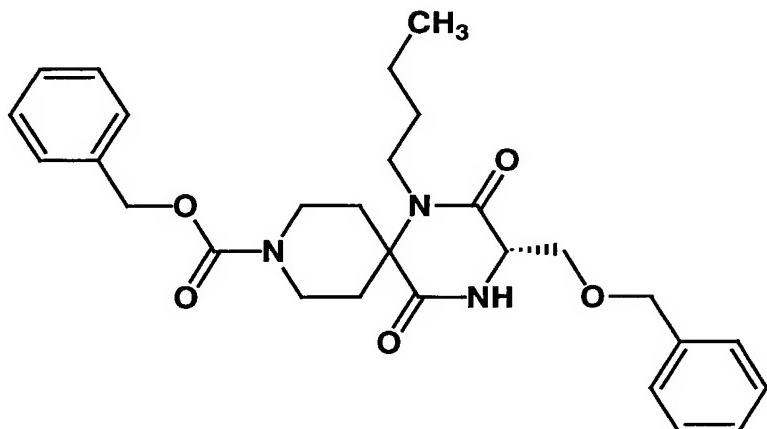


p-トルエンスルホニルクロライドの代わりに、ベンゾイルクロライドを用いて、実施例 28 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

15 TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.93 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.88 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61-7.50 (m, 5H), 4.34 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.24 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 2 9

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N - ベンジルオキシカルボニル - 4 - ピペリドン、O - ベンジル - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - セリンを用いて、参考例 3 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

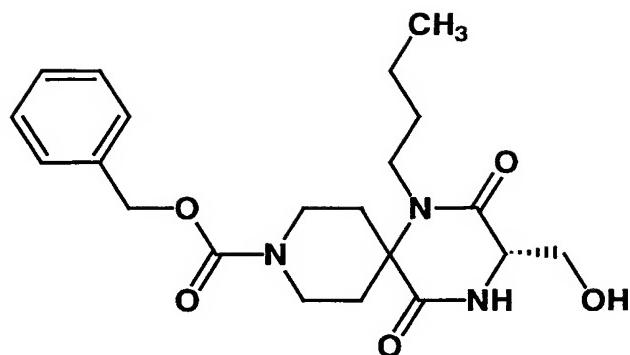
10 TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.40-7.25 (m, 10H), 6.09 (brs, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.54 (s, 2H), 4.20-3.98 (br, 2H), 4.18 (dd, J = 8.4, 3.6 Hz, 1H), 3.93 (dd, J = 9.3, 3.6 Hz, 1H), 3.80-3.56 (br, 1H), 3.66 (dd, J = 9.3, 8.4, Hz, 1H), 3.45-3.12 (m, 3H), 2.02-1.75 (m, 4H), 1.57-1.39 (m, 2H), 1.38-1.20 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15

実施例 3 0

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ

ン

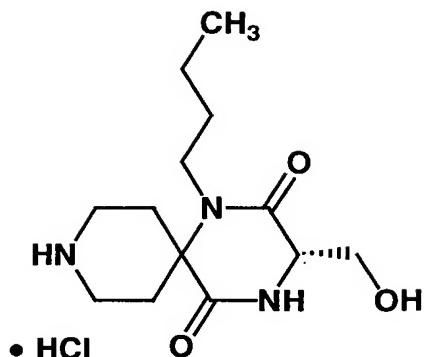


実施例 2 9 で製造した化合物（2 4 5 m g）のジクロロメタン（5 m l）
溶液に、−4 0 ℃で三臭化ホウ素の 1 M ジクロロメタン溶液（1.4 m l）を加
え、−2 0 ℃で 3 時間攪拌した。反応混合物に水と飽和炭酸水素ナトリウム
水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を水、飽和塩化ナトリウム水
溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。残渣をシリカゲル
カラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=3 0 : 1）によっ
て精製し、以下の物性値を有する本発明化合物（1 7 3 m g）を得た。
T L C : R f 0.29 (クロロホルム：メタノール=2 0 : 1) ;
N M R (CDCl₃) : δ 7.42-7.27 (m, 5H), 6.26-6.15 (br, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.26-4.00
(m, 2H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.84-3.60 (br, 1H), 3.43-3.13 (m, 4H), 2.80-2.68 (br,
1H), 2.05-1.75 (m, 4H), 1.58-1.40 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.5 Hz,
3H)。

15

実施例 3 1

(3 S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 1 , 4 ,
9 - トリアザスピロ [5 . 5] ウンデカン



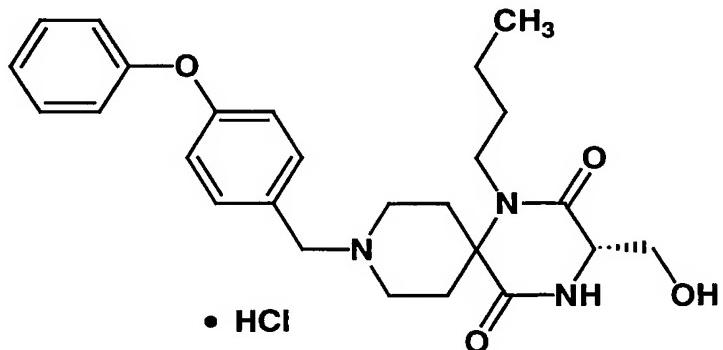
実施例 3 0 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.21 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 4 : 1) ;

5 NMR (¹H-DMSO) : δ 7.83 (brs, 1H), 5.10-4.90 (br, 1H), 3.88-3.78 (m, 1H), 3.76-3.65 (m, 1H), 3.58-3.48 (m, 1H), 3.28-3.18 (m, 1H), 3.18-3.04 (m, 3H), 2.88-2.75 (m, 2H), 1.94-1.83 (m, 1H), 1.83-1.64 (m, 3H), 1.56-1.42 (m, 1H), 1.42-1.20 (m, 3H), 0.88 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 3 2 (1)

(3S)-1-(4-フェニルオキシベンズアルデヒドと実施例 3 1 で製造した化合物を用
1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



15 4-フェニルオキシベンズアルデヒドと実施例 3 1 で製造した化合物を用

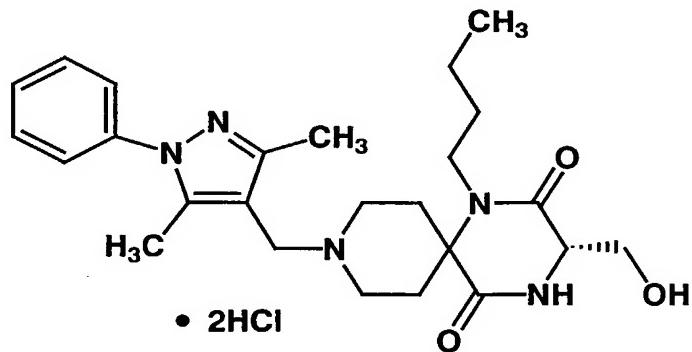
いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.22-7.14 (m, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06-7.00 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.03-3.90 (m, 3H), 3.79-3.66 (m, 1H), 3.65 (dd, J = 10.5, 2.4 Hz, 1H), 3.61-3.42 (m, 3H), 3.30-3.18 (m, 1H), 2.50-2.24 (m, 3H), 2.24-2.12 (m, 1H), 1.76-1.58 (m, 1H), 1.54-1.26 (m, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

10 実施例 32 (2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



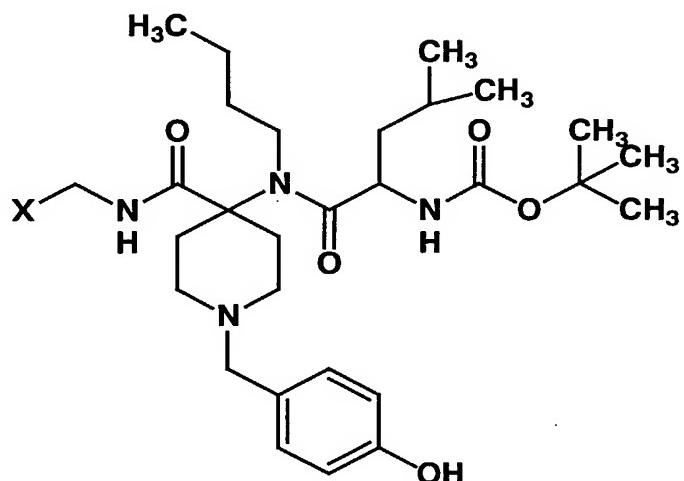
15 1-フェニル-3,5-ジメチル-4-ホルミルピラゾールと実施例 31 で製造した化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.08-3.92 (m, 3H), 3.83-3.70 (m, 1H), 3.66 (dd, J = 10.5, 2.4 Hz, 1H), 3.66-3.52 (m, 3H), 3.40-3.25 (m,

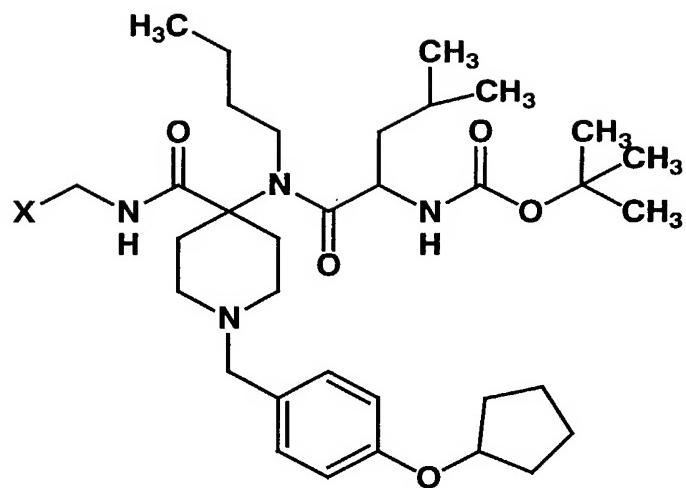
1H), 2.64-2.50 (m, 1H), 2.50-2.40 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.28-2.15 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.58-1.30 (m, 3H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

参考例 1 1：化合物（7）の合成



参考例 2 で製造した樹脂（3）およびN-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン、n-ブチルアミンおよびN-（t-ブチルオキシカルボニル）ロイシンを用いて、参考例 3→参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-ホルミルピラゾールの代わりに、4-ヒドロキシベンズアルデヒドを用いて、参考例 5 と同様の操作をし、化合物（7）を得た。

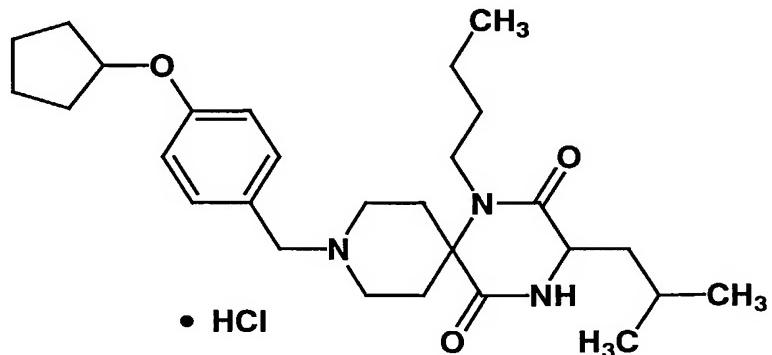
参考例 1 2：化合物（8）の合成



参考例 1 1 で製造した化合物（60mg）のジクロロメタン（2ml）懸濁液に、トリフェニルホスフィン（80mg）と1Mのシクロペンタノールのジクロロメタン溶液（0.302ml）とジエチルアゾジカルボキシレート（0.137ml）を加えた。反応混合物を室温で18時間攪拌した。反応液をろ過し、得られた樹脂をジクロロメタン（2ml×4回）、メタノール（2ml×3回）、ジクロロメタン（3ml×4回）で洗浄し、化合物（8）を得た。

実施例 3 3

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



参考例 1 2 で製造した化合物を用いて、参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

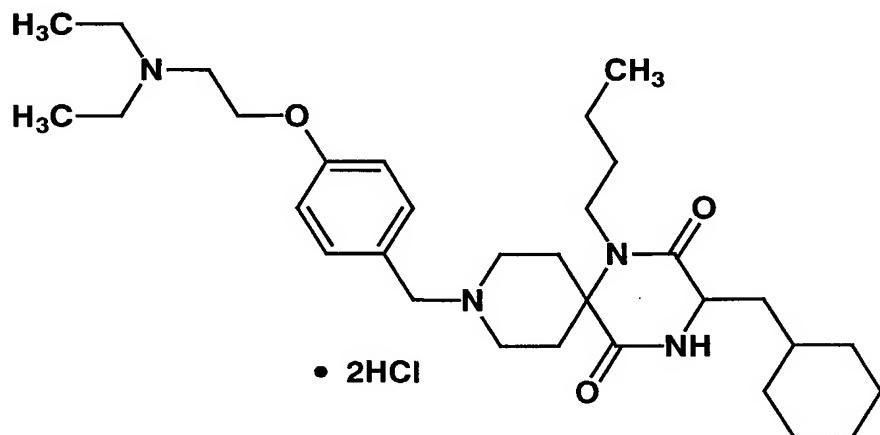
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.83 (m, 1H), 4.25 (brs, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.65 (m, 2H), 3.53-3.27 (m, 4H), 2.40-2.06 (m, 4H), 2.02-1.43 (m, 13H), 1.43-1.24 (m, 2H), 1.01-0.90 (m, 9H).

実施例 3 3 (1) ~ 3 3 (6)

n-ブチルアミンおよびN-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシンの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 1 1 と同様の操作をし、シクロペンタノールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 1 2 → 実施例 3 3 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 3 3 (1)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(2-ジエチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

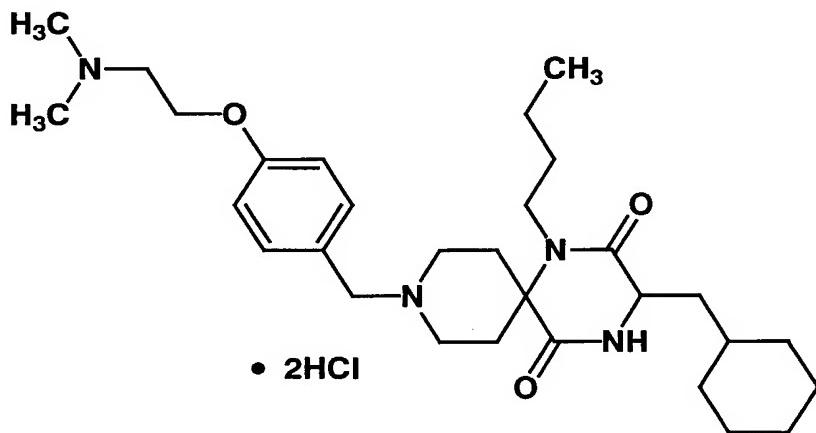


TLC : R_f 0.54 (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=80:10:1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 5.1 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.63 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 3.50-3.40 (m, 4H), 3.40-3.31 (m, 4H), 2.58-2.41 (m, 2H), 2.23-2.04 (m, 2H), 1.82-1.42 (m, 10H), 1.41-1.12 (m, 11H), 1.04-0.87 (m, 5H)。

実施例 3 3 (2)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(2-ジメチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

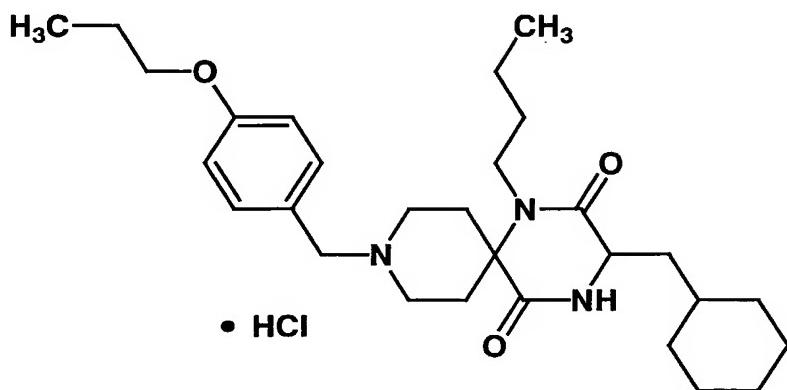


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=80:10:1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.61 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 3.50-3.38 (m, 4H), 2.98 (s, 6H), 2.59-2.42 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 3 3 (3)

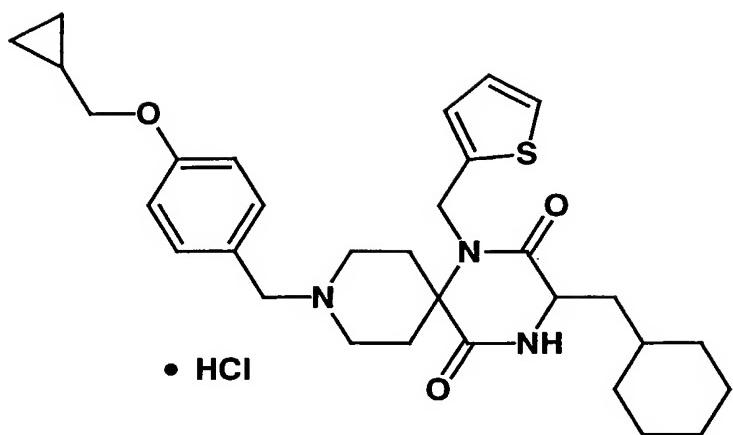
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウ
ンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.27 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.85-3.67 (m, 2H),
10 3.53-3.33 (m, 4H), 2.45-2.27 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.86-1.14 (m, 17H),
1.03 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.00-0.89 (m, 5H)。

実施例 3 3 (4)

1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1,
15 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

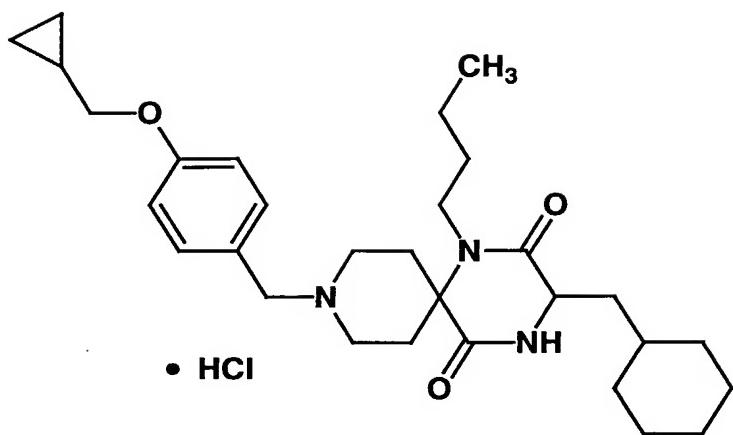


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.27 (dd, J = 5.4, 0.9 Hz, 1H),
 7.06-6.97 (m, 3H), 6.91 (dd, J = 5.4, 3.6 Hz, 1H), 4.95-4.85 (m, 2H), 4.27 (brs,
 5 2H), 4.14 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H),
 3.51-3.39 (m, 2H), 2.59-2.36 (m, 2H), 2.24-2.07 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 8H),
 1.35-1.12 (m, 4H), 1.04-0.85 (m, 2H), 0.66-0.57 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 3 3 (5)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
 [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



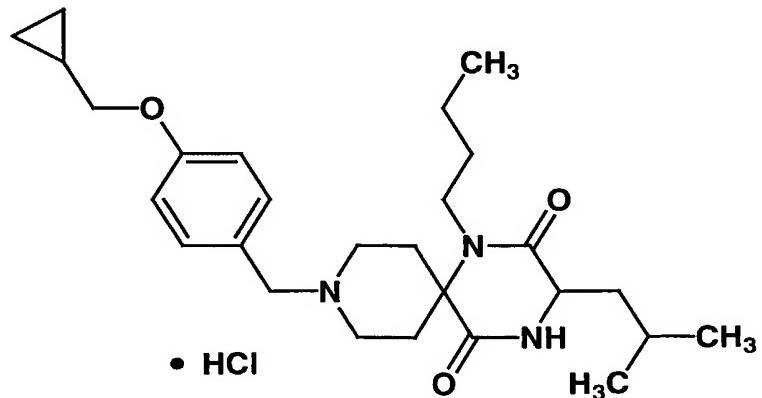
TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.26 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.83-3.66 (m, 2H),

5 3.51-3.33 (m, 4H), 2.44-2.26 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 16H), 1.04-0.86 (m, 5H), 0.66-0.57 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 3 3 (6)

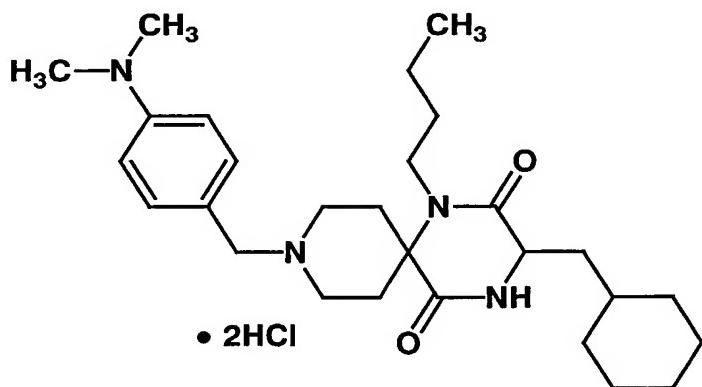
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-10 シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアズスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.55 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (brs, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.50-3.33 (m, 4H), 2.43-2.26 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.89-1.43 (m, 5H), 1.43-1.17 (m, 3H), 1.00-0.88 (m, 9H), 0.66-0.58 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 3 4

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(ジメチルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] 10 ウンデカン・2 塩酸塩



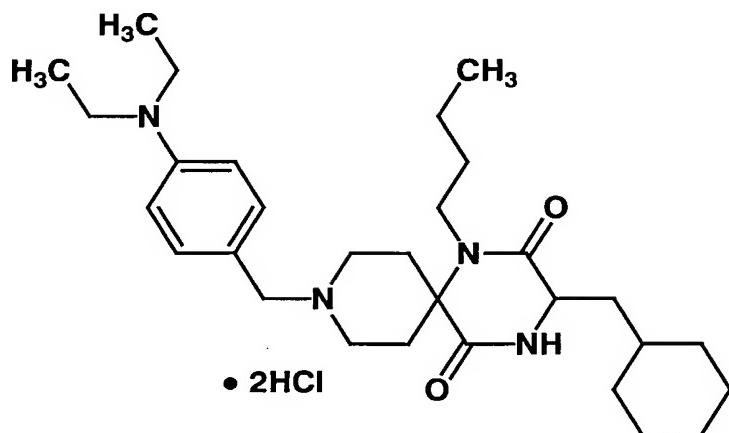
4-ジメチルアミノベンズアルデヒドと実施例 9 (1) で製造した化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

15 TLC : R_f 0.26 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8, Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 4H), 3.26 (s, 6H), 2.64-2.47 (m, 2H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 15H), 1.04-0.88 (m, 5H)。

実施例 3 4 (1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(ジエチルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]

5 ウンデカン・2塩酸塩

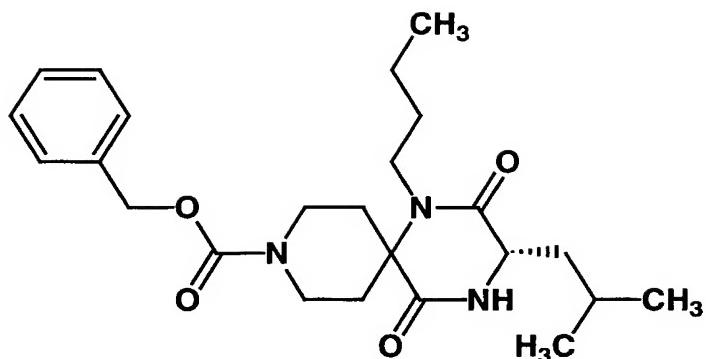


4-ジメチルアミノベンズアルデヒドの代わりに、4-ジエチルアミノベンズアルデヒドを用いて、実施例34と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 10 TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.94-7.78 (m, 2H), 7.72-7.52 (m, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8, Hz, 1H), 3.92-3.73 (m, 2H), 3.73-3.60 (m, 4H), 3.54-3.40 (m, 4H), 2.63-2.45 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 21 H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

15 実施例 3 5

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

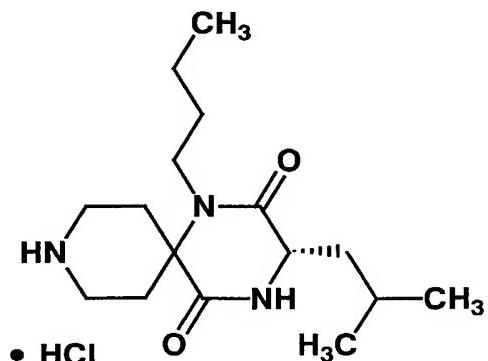


参考例 2 で製造した樹脂（3）、N-ベンジルオキシカルボニル-4-ピペリドン、n-ブチルアミン、N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシンを用いて、参考例 3→参考例 6→実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.35 (m, 5H), 6.50 (brs, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.08 (m, 2H),
 3.96 (m, 1H), 3.62 (brs, 1H), 3.44 (brs, 1H), 3.26 (m, 2H), 1.95-1.76 (m, 4H),
 1.61-1.45 (m, 5H), 1.31 (m, 2H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz,
 10 3H), 0.91 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 3 6

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



実施例 3 5 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.18 (クロロホルム : メタノール = 4 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.02 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 3.80 (dd, J = 12.5, 4.0 Hz, 1H),

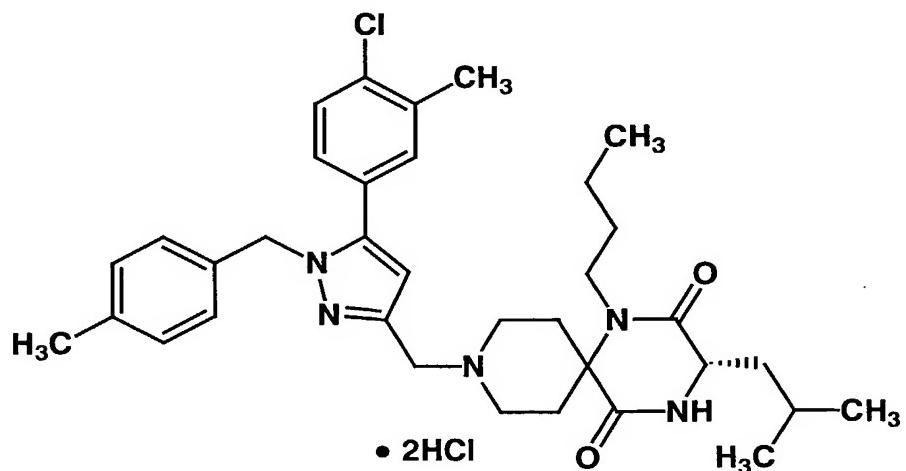
5 3.72 (dd, J = 12.5, 4.0 Hz, 1H), 3.39 (m, 4H), 2.34-2.09 (m, 4H), 1.88-1.50 (m, 5H), 1.37 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (1) ~ 3 7 (88)

10 実施例 3 6 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 3 7 (1)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-15 9-(5-(3-メチル-4-クロロフェニル)-1-(4-メチルフェニルメチル)ピラゾール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

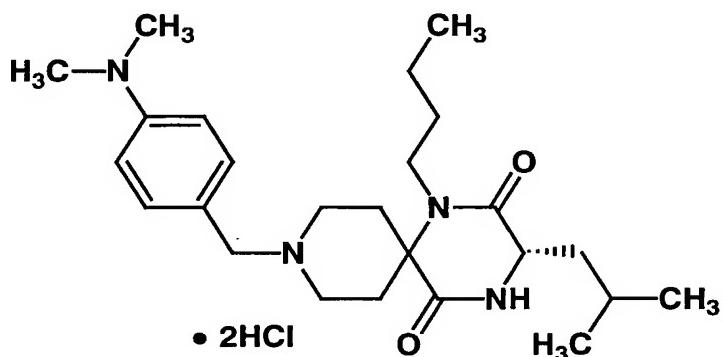


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.42 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.19 (dd, $J = 8.1, 1.5$ Hz, 1H), 7.11 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 6.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 6.65 (s, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.97-3.76 (m, 2H), 3.64-3.52 (m, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.91-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H)。

実施例 3 7 (2)

(3S)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
10 9-(4-ジメチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン・2塩酸塩



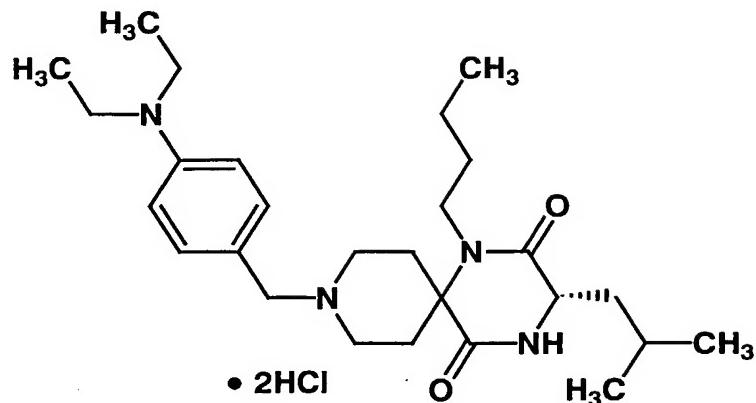
TLC : Rf 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.78 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.58 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 3.26 (s, 6H), 2.56 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.88-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (3)

(3S)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

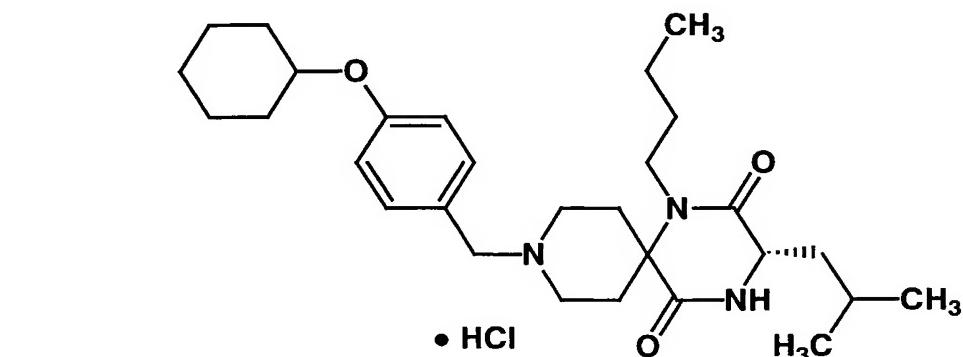


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.96-7.82 (m, 2H), 7.74-7.55 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.60 (m, 6H), 3.55-3.40 (m, 4H), 2.65-2.48 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.89-1.26 (m, 7H), 1.15 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00-0.87 (m, 9H).

実施例 37 (4)

(3S)-1-(2-methylpropyl)-5-oxo-3-(2-methylpropyl)-1,4-dihydro-2H-pyrazine-2-carboxylic acid dihydrochloride
9-(4-cyclohexylmethoxyphenyl)-1,4-dihydro-2H-pyrazine-2-carboxylic acid dihydrochloride



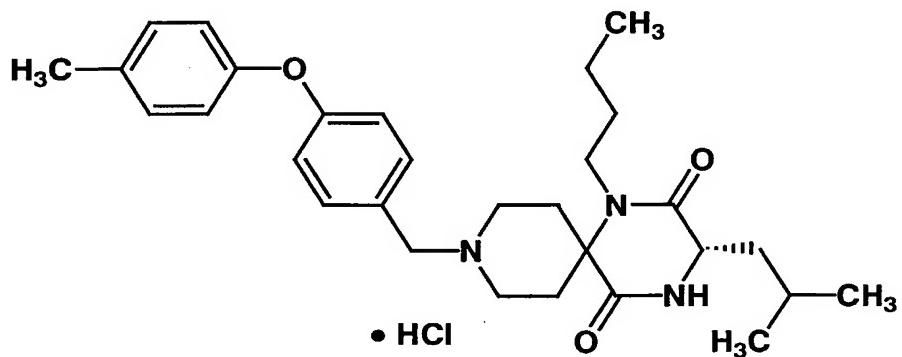
TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.45-7.42 (m, 2H), 7.02-6.99 (m, 2H), 4.40-4.31 (m, 1H),

4.27 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 8.0, 4.5$ Hz, 1H), 3.83-3.70 (m, 2H), 3.47 (brd, 2H), 3.42-3.35 (m, 2H), 2.43-2.32 (m, 2H), 2.24-2.11 (m, 2H), 2.00-1.93 (m, 2H), 1.86-1.32 (m, 15H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

5 実施例 3 7 (5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

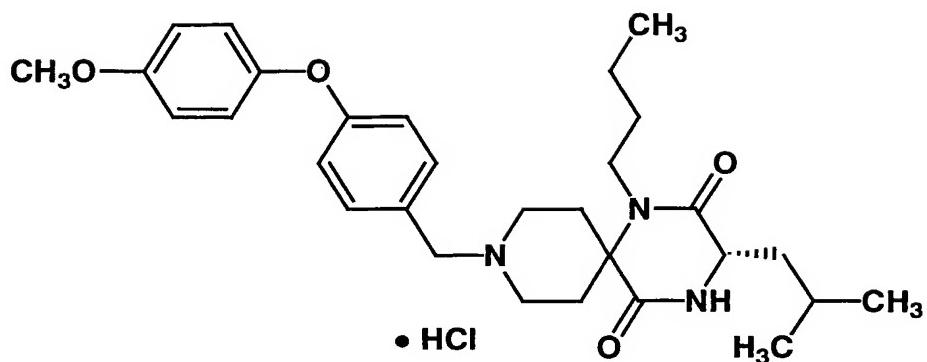


10 TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52-7.47 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 7.04-7.00 (m, 2H), 6.94-6.90 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 8.0, 4.5$ Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.48 (brd, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.45-2.33 (m, 5H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.85-1.48 (m, 5H), 1.41-1.31 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

15

実施例 3 7 (6)

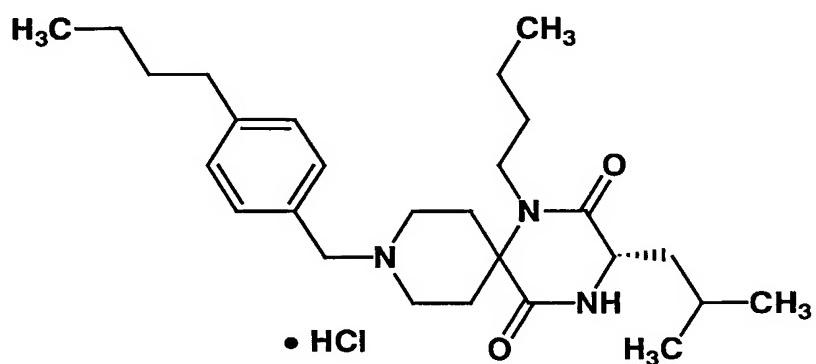
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.65 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.49-7.46 (m, 2H), 7.00-6.94 (m, 6H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.71 (m, 5H), 3.48 (brd, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.42-5 2.30 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.83-1.48 (m, 5H), 1.41-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (7)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-10-9-(4-ブチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

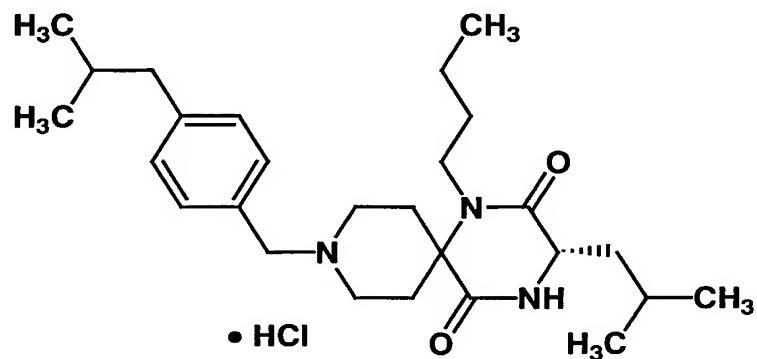


TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.67 (t, 15 1H), 1.35 (s, 9H)。

$J = 7.8$ Hz, 2H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 11H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5 実施例 3 7 (8)

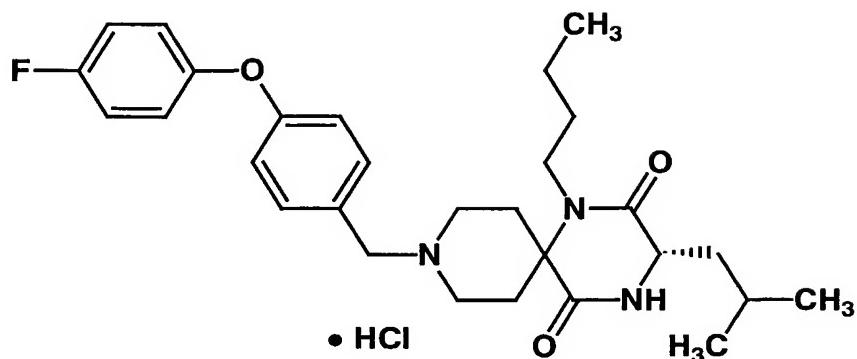
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(2-メチルプロピル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.33 (s, 2H),
 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.34 (m, 4H), 2.53 (d, $J =$
 7.2 Hz, 2H), 2.53-2.30 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.96-1.26 (m, 8H), 0.95 (t, $J =$
 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.91 (d, $J = 6.6$ Hz,
 15 6H)。

実施例 3 7 (9)

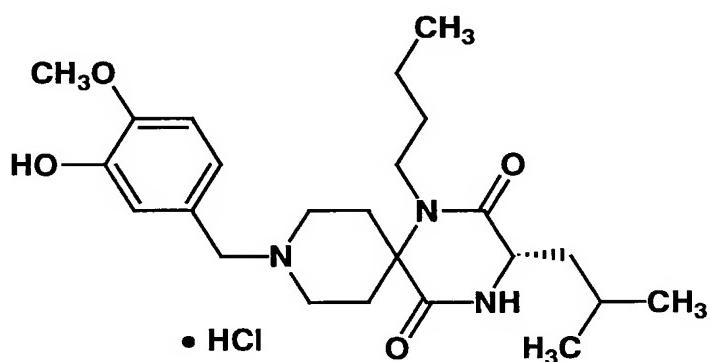
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-フルオロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩
 20



TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.16 - 7.04
 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.58-3.36
 5 (m, 4H), 2.46-2.10 (m, 4H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J
 = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (10)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
 アザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

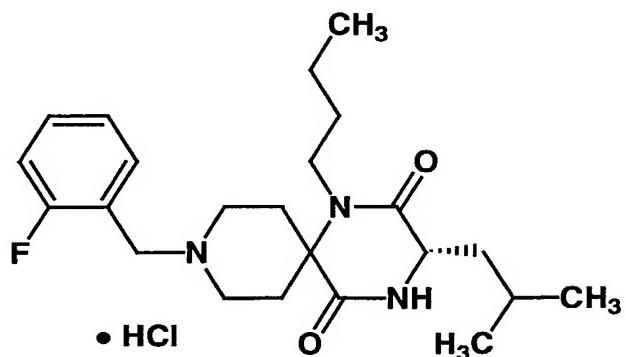


TLC : R_f 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.03-6.94 (m, 3H), 4.23 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz,
 15 1H), 3.89 (s, 3H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.88-

1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (1 1)

5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

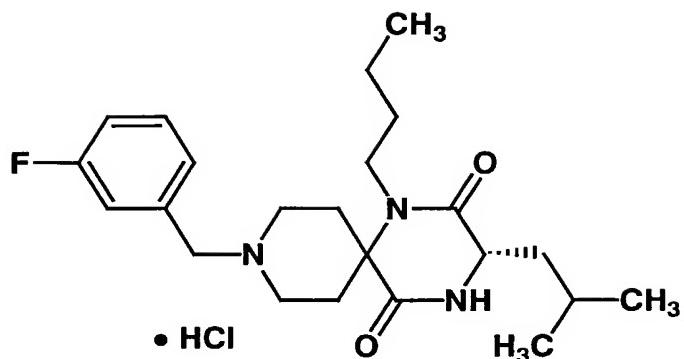


TLC : R_f 0.48 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.64-7.54 (m, 2H), 7.37-7.27 (m, 2H), 4.45 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.81 (m, 2H), 3.54 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.82-1.49 (m, 5H), 1.35 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (1 2)

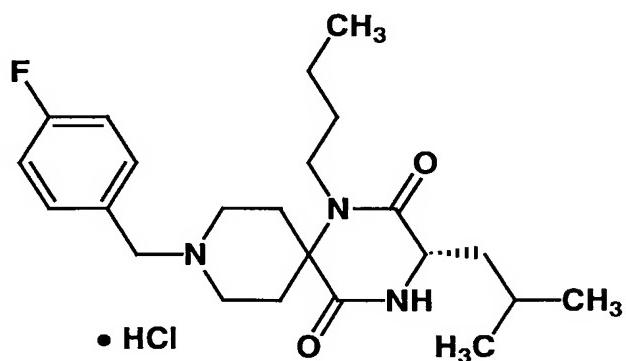
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (dt, J = 8.3, 6.0 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 2H), 7.26 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.89-3.76 (m, 2H), 3.50-5.38 (m, 4H), 2.48-2.38 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.84-1.75 (m, 1H), 1.72-1.46 (m, 4H), 1.42-1.28 (m, 2H), 0.99-0.92 (m, 9H)。

実施例 3 7 (13)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

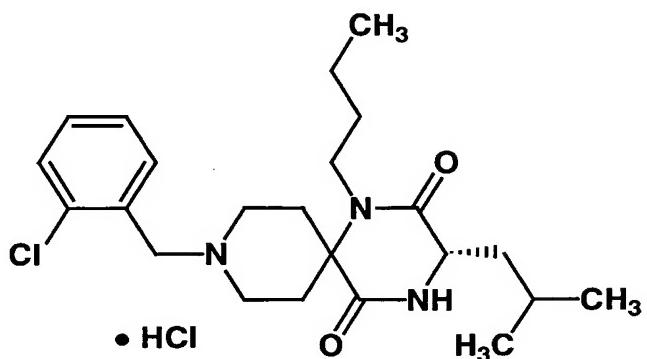


TLC : R_f 0.33 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.60 (dd, J = 8.7, 5.4 Hz, 2H), 7.24 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.49-3.35 (m, 4H), 2.44-2.13

(m, 4H), 1.84-1.46 (m, 5H), 1.37 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 9H)。

実施例 3 7 (1 4)

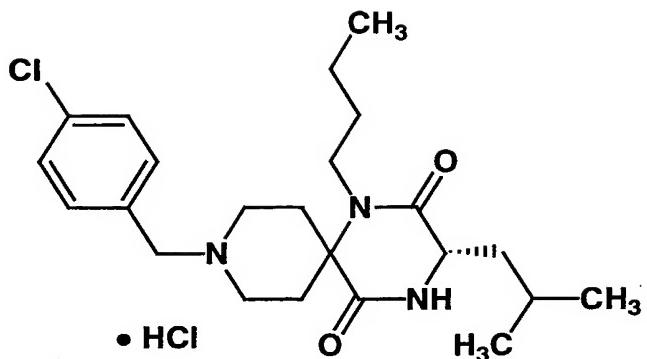
15 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.62 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;
10 NMR (CD_3OD) : δ 7.72 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.60 (dd, $J = 8.0, 1.5$ Hz, 1H),
7.56-7.45 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.94 (m, 2H), 3.55
(m, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.43-2.37 (m, 2H), 2.26-2.13 (m, 2H), 1.85-1.46 (m,
5H), 1.35 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 3 7 (1 5)

15 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-クロロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



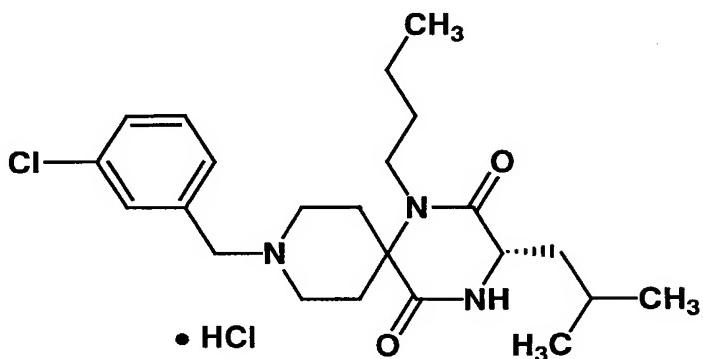
TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.51-3.34 (m, 4H), 2.49-

5 2.52 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.29 (m, 2H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 37 (16)

(3S)-1-(2-chlorophenyl)-2-[2-(2-methylpropyl)-4,9-diazaspiro[5.5]undecyl]-3-(2-methylpropyl)propan-1-amine
10 9-(3-chlorophenyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecane · hydrochloride



TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

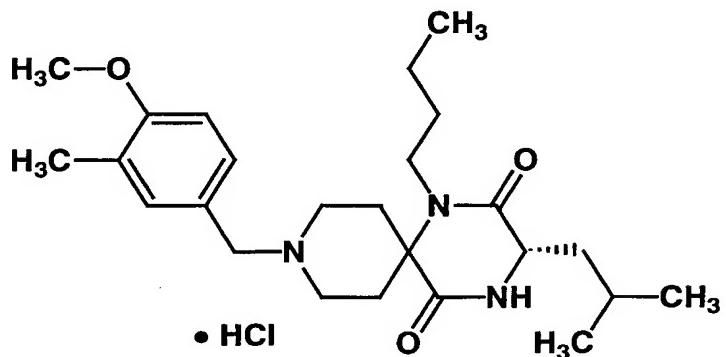
NMR (CD₃OD) : δ 7.68-7.64 (m, 1H), 7.56-7.45 (m, 3H), 4.37 (s, 2H), 4.00 (dd,

15 J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.72 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.53-2.34 (m, 2H),

2.27-2.08 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.27 (m, 2H), 0.99-0.89 (m, 9H)。

実施例 3 7 (1 7)

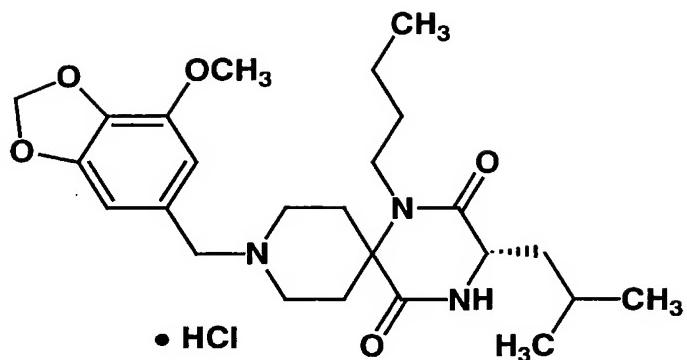
5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチル-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.38-7.30 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (s, 2H),
 10 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.85-3.65 (m, 2H), 3.52-3.33 (m, 4H),
 2.50-2.30 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.20-2.07 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.28
 (m, 2H), 0.99-0.88 (m, 9H)。

実施例 3 7 (1 8)

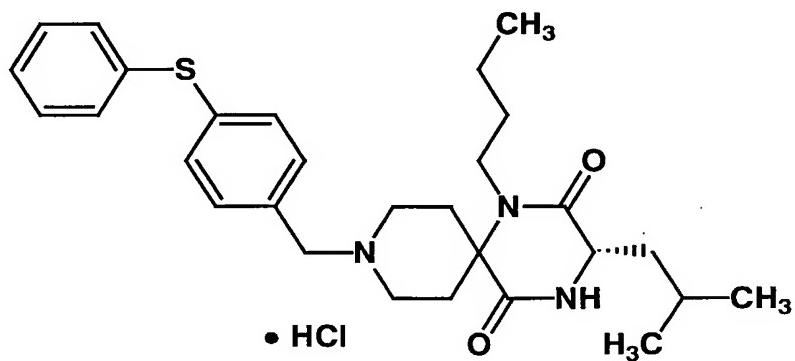
15 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(7-メトキシ-1,3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 6.85 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 5.99 (s, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.87-3.66 (m, 2H),
 5 3.52-3.32 (m, 4H), 2.52-2.34 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H),
 1.43-1.29 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (19)

(3S)-1-(2-methylpropyl)-5-((2-methoxyphenyl)thio)-3-(4-methoxyphenyl)piperidin-4-one
 10 -9-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

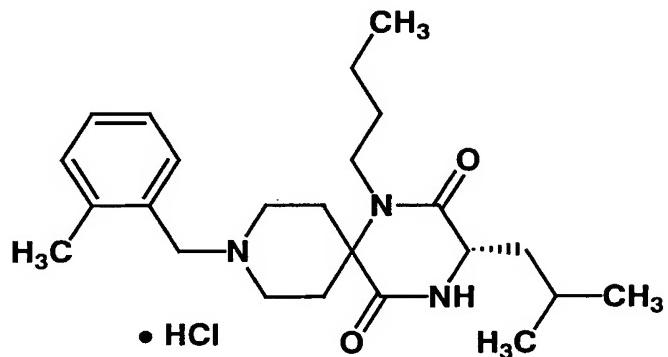


TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.50-7.36 (m, 7H), 7.30 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H),
 15 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.53-3.32 (m, 4H), 2.50-2.30 (m,

2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.42-1.27 (m, 2H), 0.98-0.89 (m, 9H)。

実施例 3 7 (2 0)

(3S) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
5 9 - (2 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン・塩酸塩

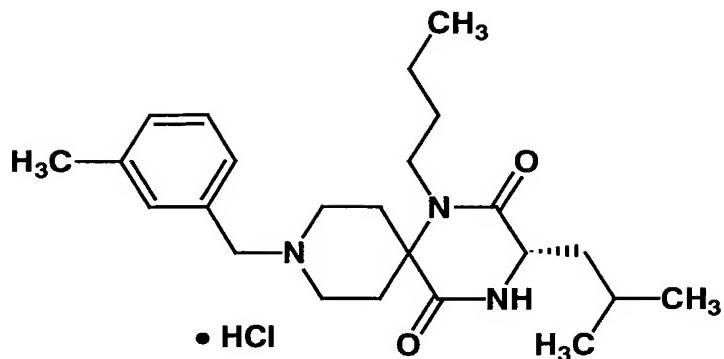


TLC : Rf 0.41 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.57 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.42-7.28 (m, 3H), 4.41 (s, 2H),
10 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.89 (m, 2H), 3.53 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.48 (s,
3H), 2.48 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.36 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H),
0.94 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (2 1)

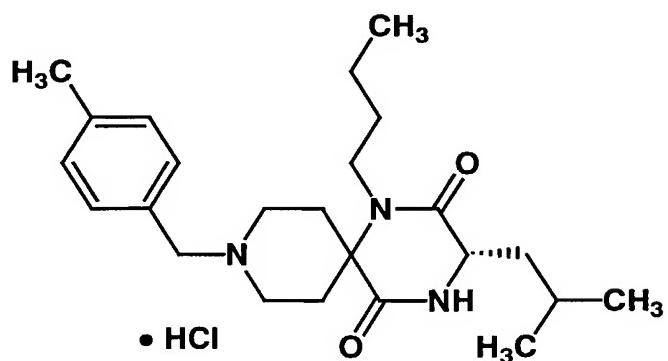
(3S) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.41-7.29 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 2.40 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.17 (m, 2H), 5 1.90-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (22)

(3S)-1-(4-methylphenyl)-5-((2R,3S)-2,3-dimethylbutyl)-3-(2-methylpropyl)azepane
 10 -9-(4-methylfennylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan・塩酸塩

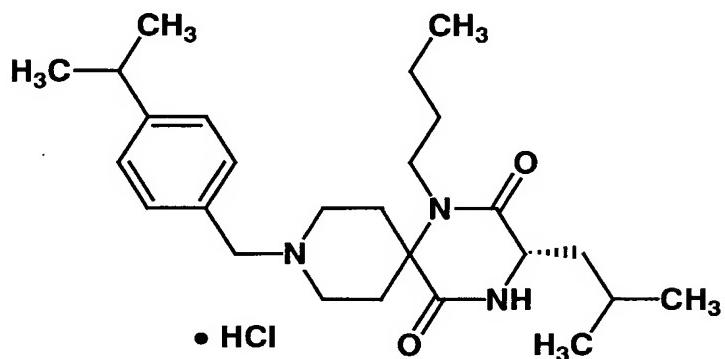


TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.31 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.31 (s, 15 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.52-3.35 (m, 4H), 2.40 (m,

2H), 2.37 (s, 3H), 2.17 (m, 2H), 1.88-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (2 3)

5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(1-メチルエチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



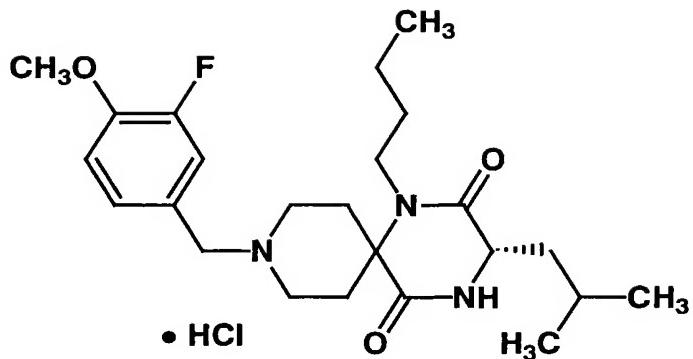
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 3.04-2.88 (m, 1H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.9 Hz, 3H)。

15

実施例 3 7 (2 4)

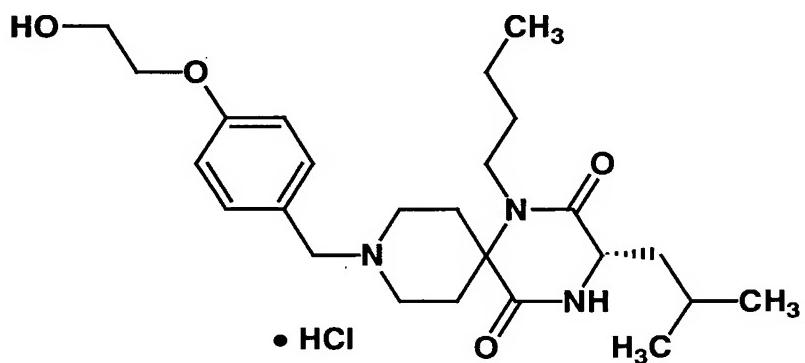
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フルオロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.32 (m, 2H), 7.21 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.86-3.64 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.56-2.32
 5 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (25)

(3S)-1-(2-methylpropyl)-5-[2-(4-hydroxyethyl)ethyl]azepane-3-(2-methylpropyl) -
 10 9-(4-(2-hydroxyethyl)ethyl) - 1, 4, 9 -トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

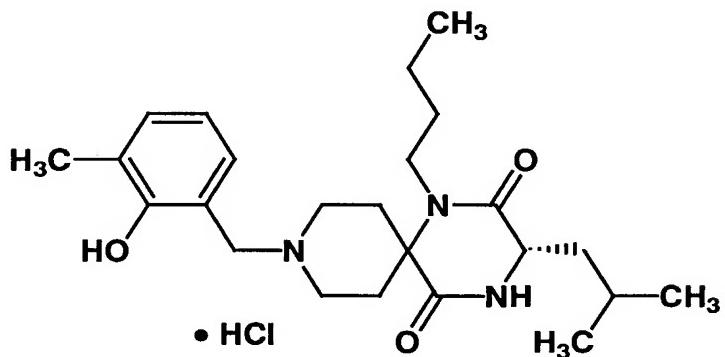


TLC : R_f 0.22 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.29 (s,
 15 2H), 4.09 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88 (t, J = 5.1 Hz,

2H), 3.86-3.64 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 3 7 (2 6)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ヒドロキシ-3-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

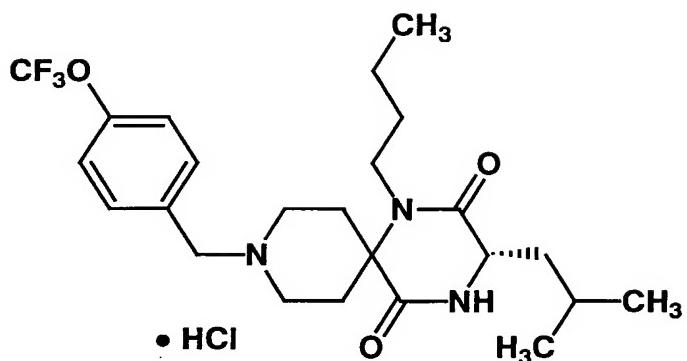


10 TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.24 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 6.89 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.76 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.44-2.08 (m, 4H), 2.89 (s, 3H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

15

実施例 3 7 (2 7)

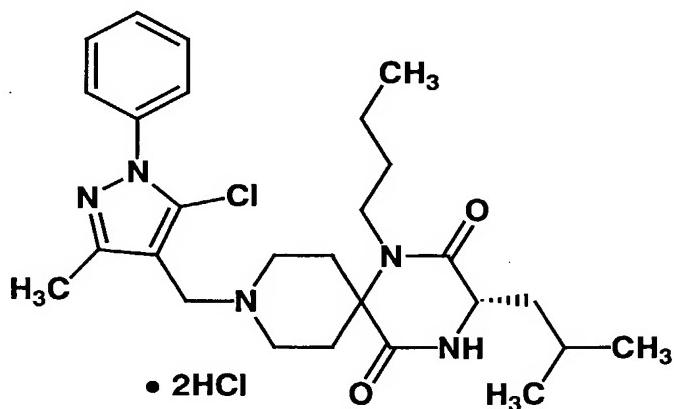
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-トリフルオロメチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.71 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.56-5 2.36 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (28)

(3S)-1-(3-(2-methylpropyl)-5-(2-(3-methyl-5-(2-(2-methylpropyl)-4-(1-methyl-4-(triaza)dipropyl)-1-phenylpiperidin-3-yl)phenyl)-1-phenylpiperidin-3-yl)-2-methylpropanamide dihydrochloride

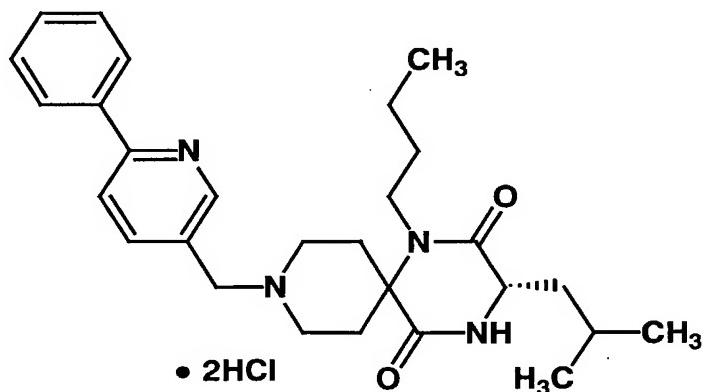


TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.50 (m, 5H), 4.35 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz,

1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.72-3.58 (m, 2H), 3.46-3.38 (m, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.36-2.18 (m, 2H), 1.92-1.24 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 3 7 (29)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルピリジン-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

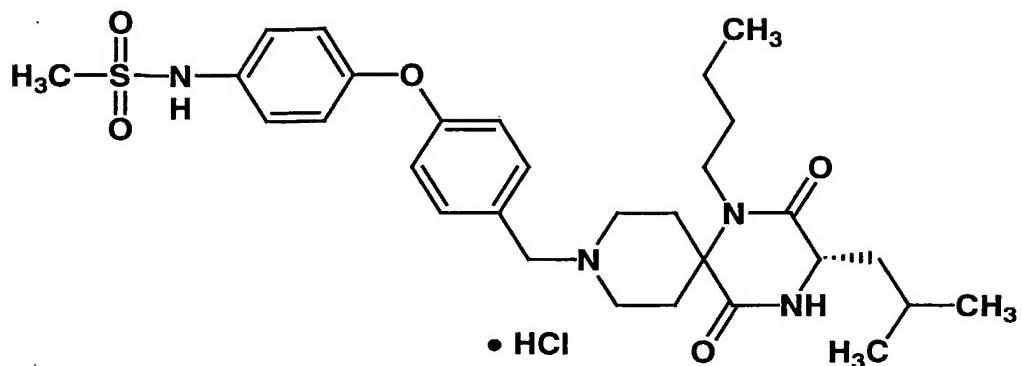


10 TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.17 (s, 1H), 8.80 (m, 1H), 8.39 (m, 1H), 8.03-7.97 (m, 2H), 7.73-7.65 (m, 3H), 4.65 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.2 Hz, 1H), 4.02-3.82 (m, 2H), 3.64-3.42 (m, 2H), 3.78-3.56 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

15

実施例 3 7 (30)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

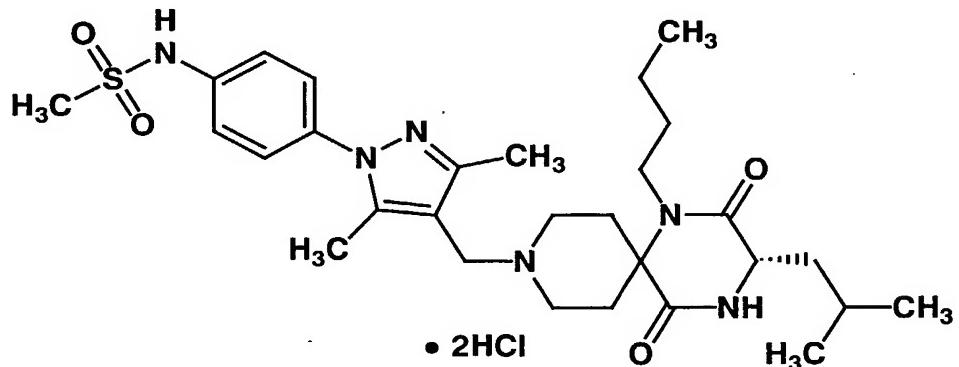


TLC : R_f 0.18 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.96 (s, 3H), 2.50-2.08 (m, 4H), 1.88-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (31)

(3S)-1-(4-(4-methylphenyl)phenyl)-2-(2-methylpropyl)-9-(3,5-dimethyl-1-(4-methylsulfonylphenyl)pyrazin-2-yl)-4,9-diaza-5-azabicyclo[5.5.0]decane-2,4-dione [5.5] ウンデカン・2塩酸塩

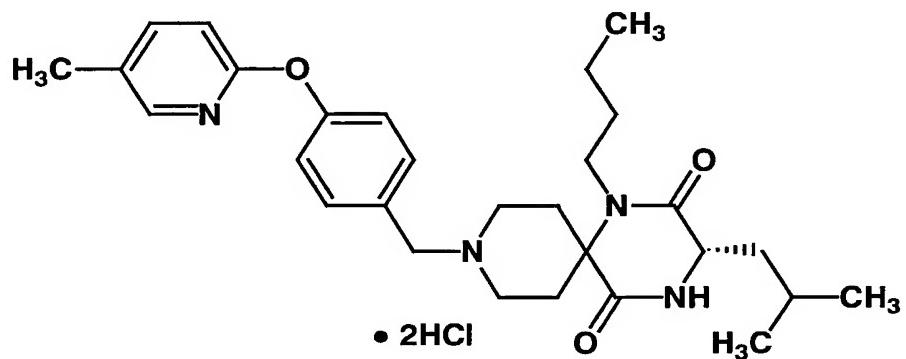


TLC : R_f 0.15 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.49 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.43 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.96-3.76 (m, 2H), 3.66-3.58 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 2.68-2.46 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.10 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.97 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H),
5 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (3 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(5-メチルピリジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1,
10 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



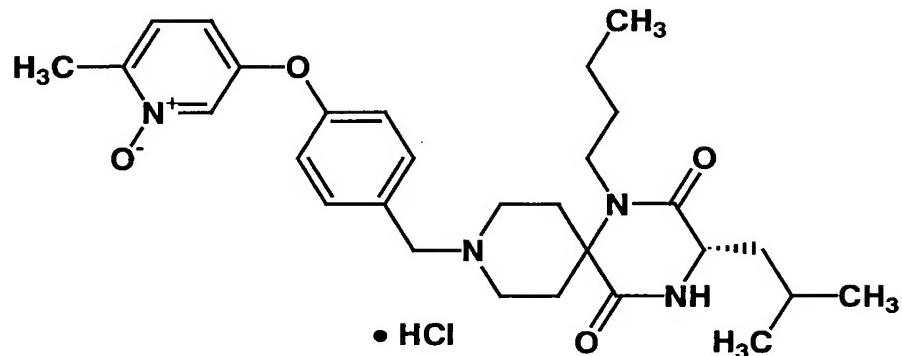
TLC : Rf 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.12 (s, 1H), 7.93 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.06 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.94-3.76 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.56-2.36 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, $J = 7.8$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (3 3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(6-メチルピリジン-1-オキシド-3-イルオキシ)フェニ

ルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

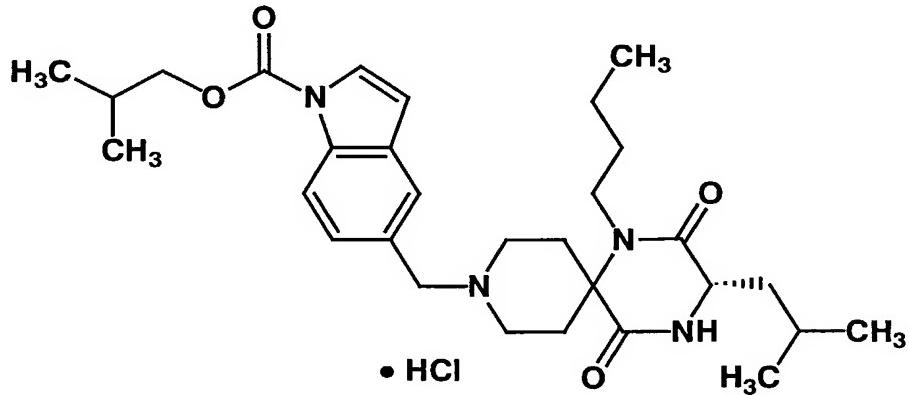


TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.47 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.62 - 7.48 (m, 2H),
5 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.72 (m,
2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.64-2.40 (m, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.90-
1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz,
3H)。

10 実施例 37 (34)

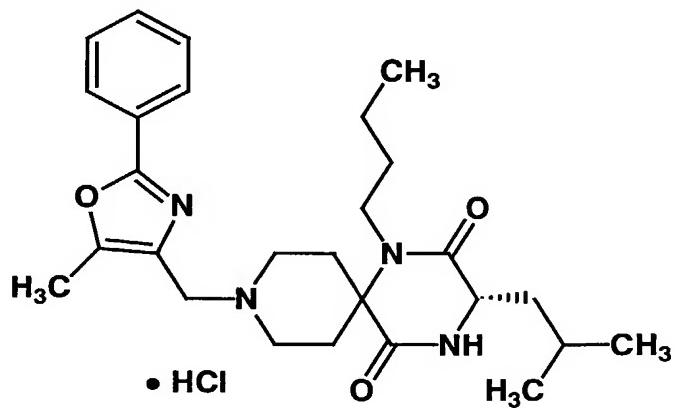
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イル
メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.4, 1.5 Hz, 1H), 6.75 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.46 (s, 2H), 4.27 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.74 (m, 2H), 3.58-5 3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 3H), 1.88-1.24 (m, 7H), 1.09 (s, 3H), 1.06 (s, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (35)

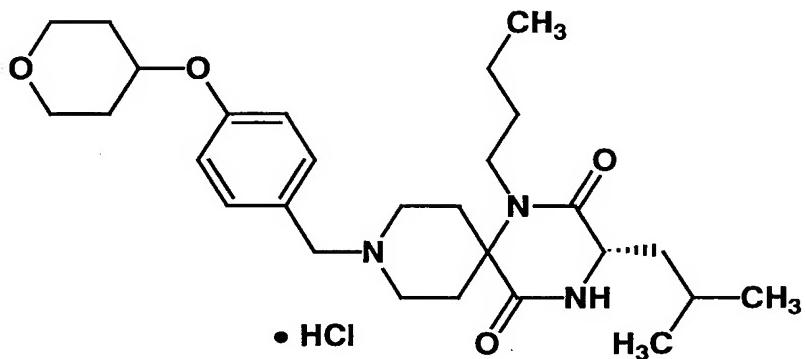
10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 8.05-8.02 (m, 2H), 7.52-7.50 (m, 3H), 4.35 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.53-2.36 (m, 2H), 2.34-2.14 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

20 実施例 37 (36)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1 ,
 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

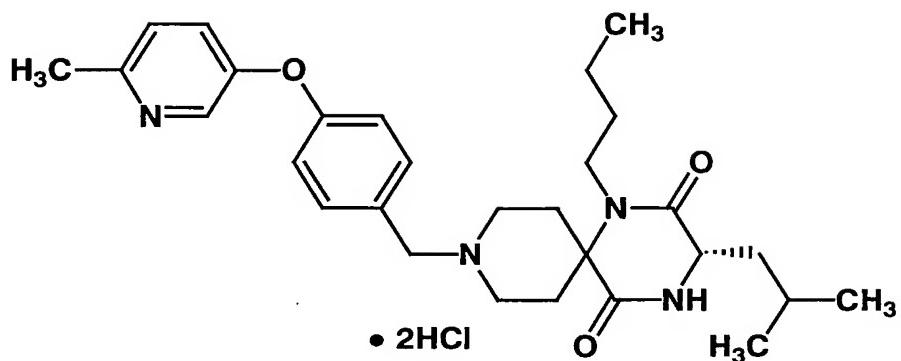


5 TLC : Rf 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.47 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.64 (m, 1H), 4.29 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.98-3.91 (m, 2H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.64-3.56 (m, 2H), 3.50-3.37 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.24-1.98 (m, 4H), 1.88-1.26 (m, 9H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H).

10

実施例 37 (37)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1 ,
 15 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

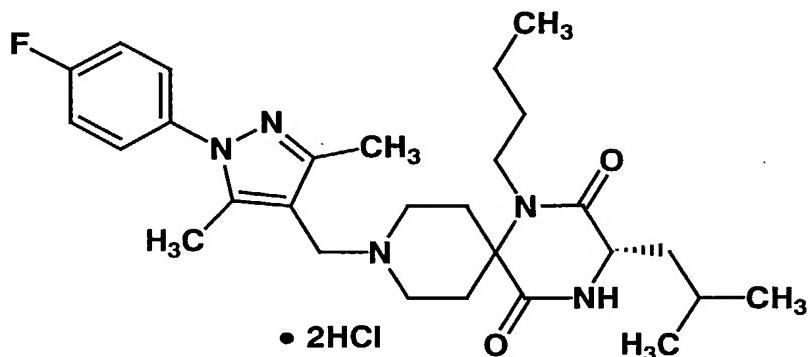


TLC : R_f 0.22 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.55 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 9.0, 2.7 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 5 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.70 (m, 2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.74 (s, 3H), 2.60-2.42 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (38)

10 (3S)-1-(2-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-フルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



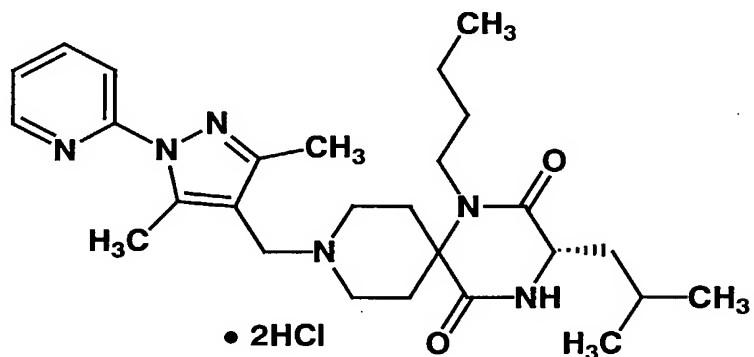
15 TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.55-7.46 (m, 2H), 7.36-7.25 (m, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.73 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 2H), 2.63-2.45 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.30 (m, 2H), 0.99-0.91 (m, 9H)。

5

実施例 3 7 (3 9)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(ピリジン-2-イル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

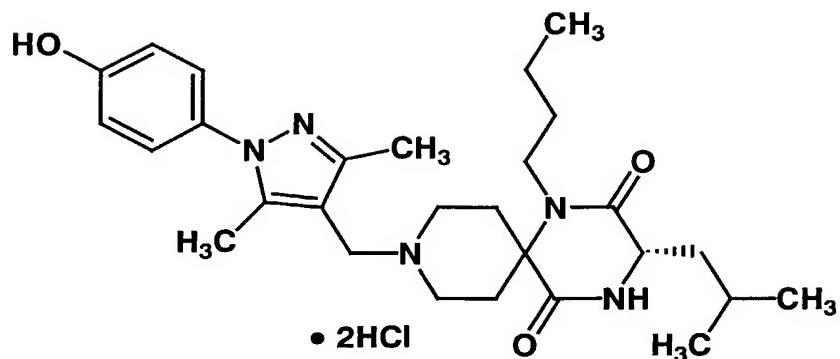
TLC : Rf 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.55 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.73 (m, 2H), 3.67-3.55 (m, 2H), 3.54-3.40 (m, 2H), 2.69 (s, 3H), 2.70-2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.92-1.43 (m, 5H), 1.43-1.26 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 3 7 (4 0)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-ヒドロキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

酸塩

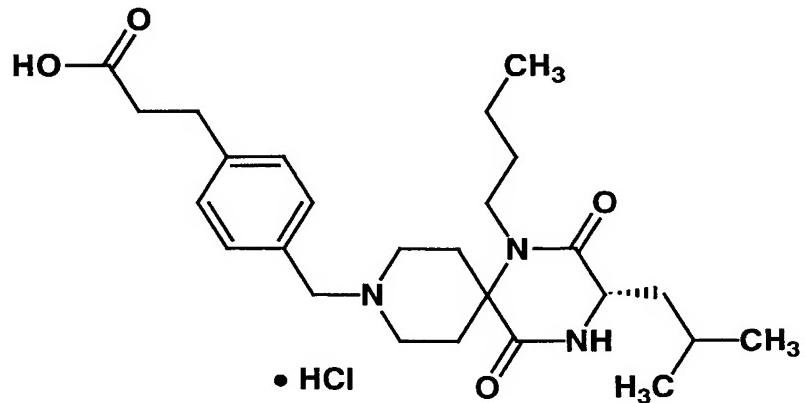


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.95 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H),
 5 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.77 (m, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.47 (m, 2H),
 2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.88-1.76 (m, 1H), 1.73-
 1.32 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz,
 3H)。

10 実施例 37 (41)

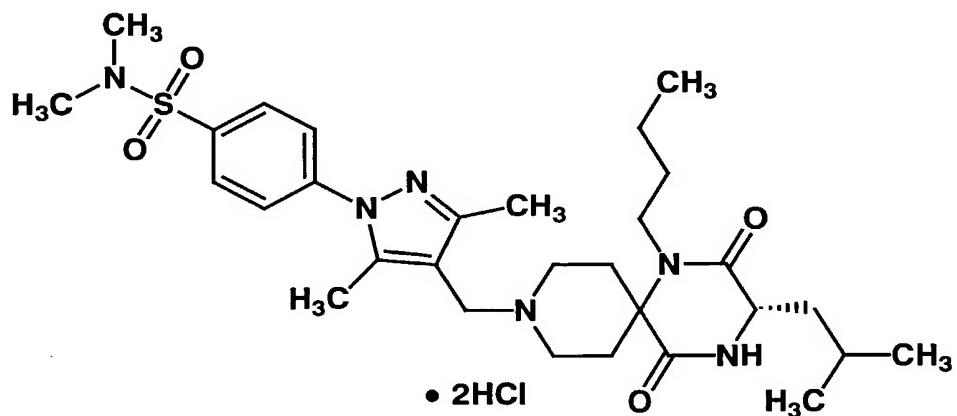
(3S)-1-(2-(4-hydroxyphenyl)-5-methylisoxazol-3-yl)-2-(2-methylpropyl)-9-((4-(2-carboxyethyl)phenyl)methyl)-4,9-dihydro-1H-pyrazocine-4,9-dione
 ハイドロchl



TLC : Rf 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H),
 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.49-3.35 (m, 4H), 2.96 (t, J =
 7.5 Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.44-2.33 (m, 2H), 2.23-2.11 (m, 2H), 1.84-
 5 1.32 (m, 7H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz,
 3H)。

実施例 37 (42)

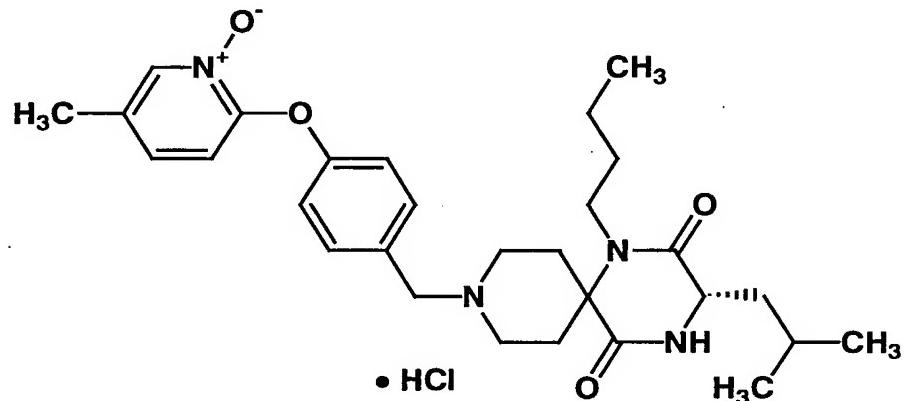
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-10-(3,5-ジメチル-1-(4-(ジメチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : Rf 0.54 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.96 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s,
 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.95-3.75 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.47
 (m, 2H), 2.74 (s, 6H), 2.56 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30-2.12 (m,
 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.38 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.98-0.93 (m, 9H)。

20 実施例 37 (43)

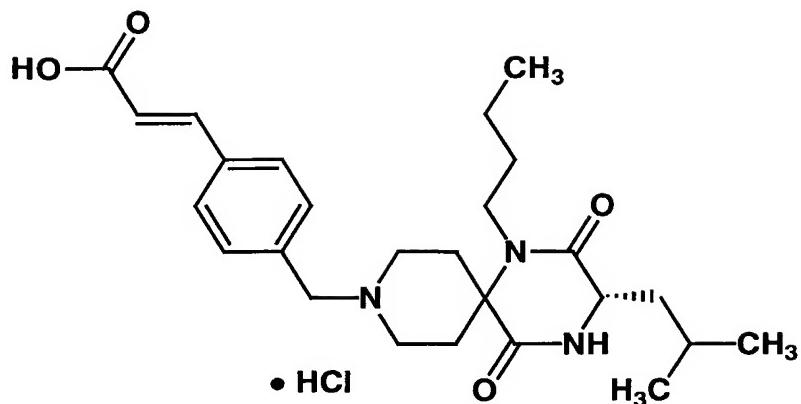
(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (5 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 2 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



5 TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.77 (brs, 1H), 7.65-7.59 (m, 2H), 7.56 (dd, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 7.03-6.97 (m, 2H), 6.73 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.51-3.36 (m, 4H), 2.46 (m, 2H), 2.25-2.07 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.97-0.91 (m, 10 9H)。

実施例 37 (44)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (2 - カルボキシ - 1 - エテニル) フェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

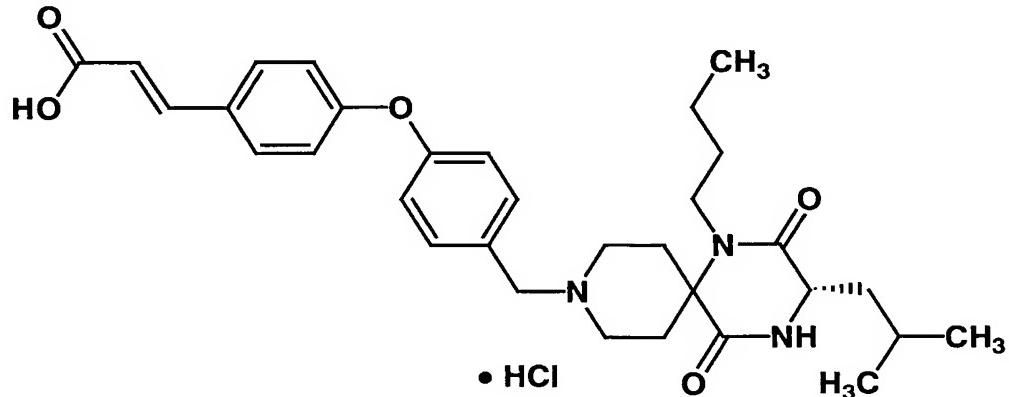


TLC : R_f 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.58 (d, J = 16.2 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (45)

(3S)-1-(4-((2S,3S)-2,3-dimethyl-1-(2-methylpropyl)aziridine-2-carbonyl)phenyl)-2-hydroxybut-1-enyl phenyl ether [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

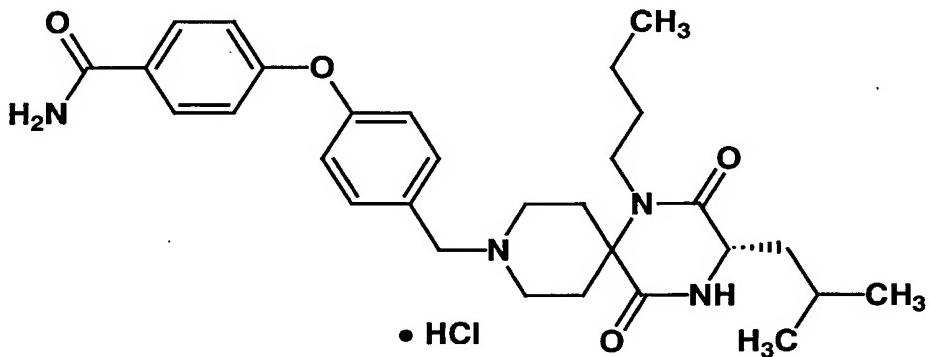
NMR (CD₃OD) : δ 7.69-7.57 (m, 5H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.42 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.88-1.25 (m, 7H), 0.98-0.88 (m, 9H)。

5

実施例 3 7 (4 6)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-アミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

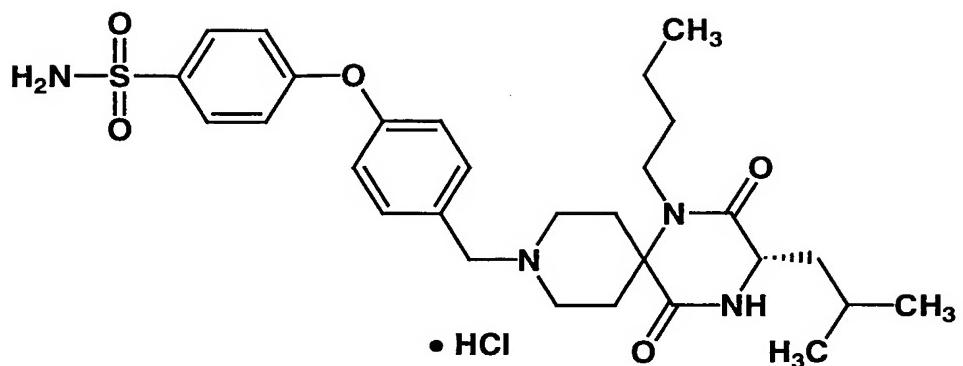
10



TLC : Rf 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.90 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5, Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.58-3.35 (m, 4H), 2.54-2.36 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 1.00-0.86 (m, 9H)。

実施例 3 7 (4 7)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-アミノスルホニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

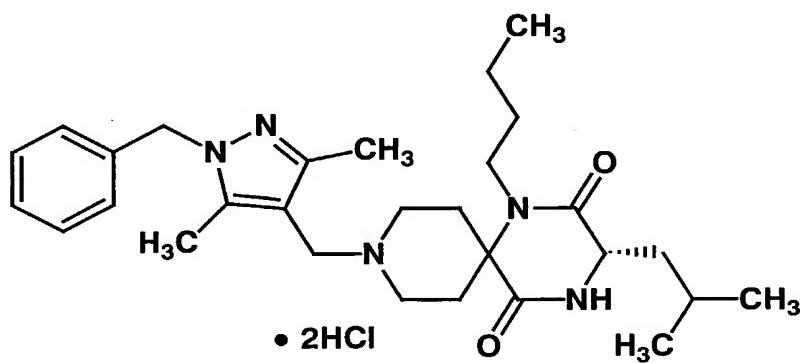


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.90 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.57 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.17 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.13 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.28 (brs, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.5$, Hz, 1H), 3.83-3.60 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.44- 2.26 (m, 2H), 2.26-2.09 (m, 2H), 1.89-1.26 (m, 7H), 1.00-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (48)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(3,5-ジメチル-1-ペンジルピラゾール-4-イルメチル)-1,
4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



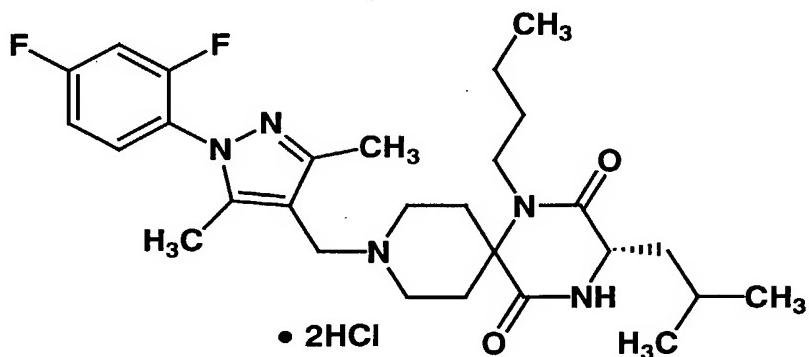
TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

¹H NMR (CD_3OD) : δ 7.41-7.33 (m, 3H), 7.21-7.19 (m, 2H), 5.45 (s, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.89-3.73 (m, 2H), 3.60-3.46 (m, 4H), 2.61

(m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.23-2.11 (m, 2H), 1.87-1.31 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (4 9)

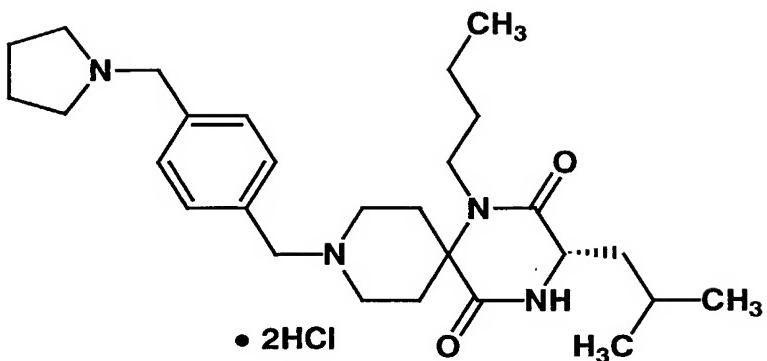
5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(2,4-ジフルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10 TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.53 (m, 1H), 7.33-7.26 (m, 1H), 7.23-7.16 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.63-3.56 (m, 2H), 3.49-3.45 (m, 2H), 2.57 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.86-1.34 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (5 0)

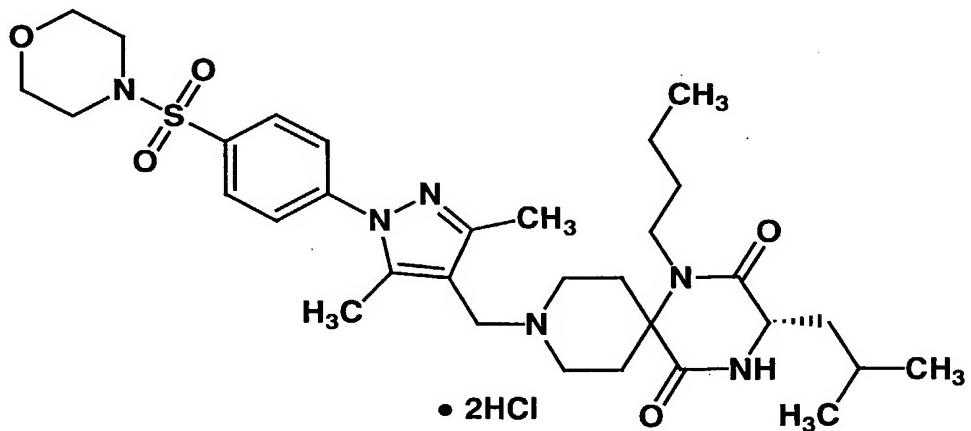
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.10 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.40 (m, 5H), 3.25-3.12 (m, 2H), 2.68-2.48 (m, 2H), 2.28-1.95 (m, 6H), 1.88-1.42 (m, 5H), 1.42-1.30 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (51)

(3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(モルホリン-4-イルスルホニル)
 フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
 5]ウンデカン・2塩酸塩

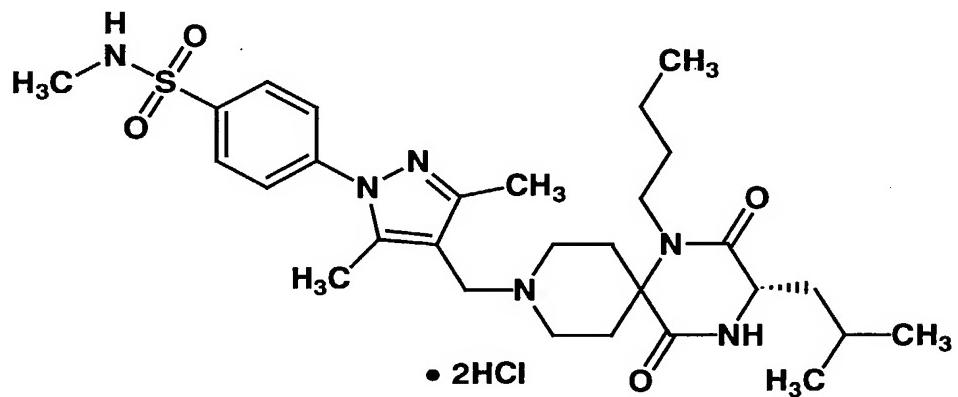


TLC: R_f 0.43 (クロロホルム:メタノール=20:1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.95 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.80 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.95-3.72 (m, 2H), 3.76-3.67 (m, 4H), 3.66-3.57 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.08-2.95 (m, 4H), 2.70-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.31-2.10 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 1.00-0.91 (m, 9H)。

実施例 3 7 (5 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-(メチルアミノスルホニル)フェニル)フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

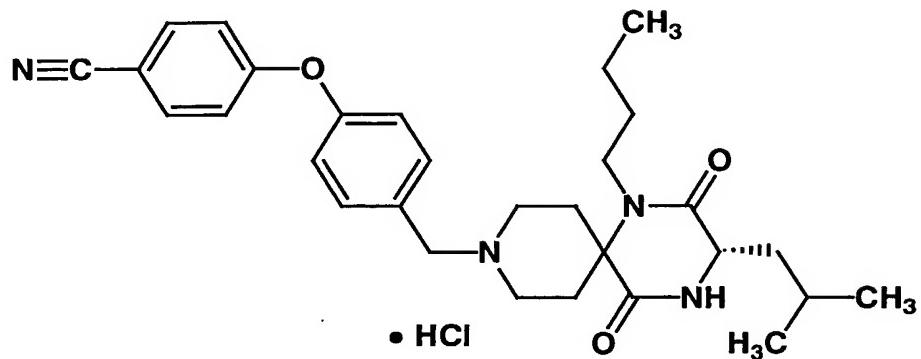


TLC : Rf 0.21 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 8.01 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.73 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.98-3.78 (m, 2H), 3.66-3.58 (m, 2H), 3.44-3.30 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.54-2.38 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H)。

実施例 3 7 (5 3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-

9-(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

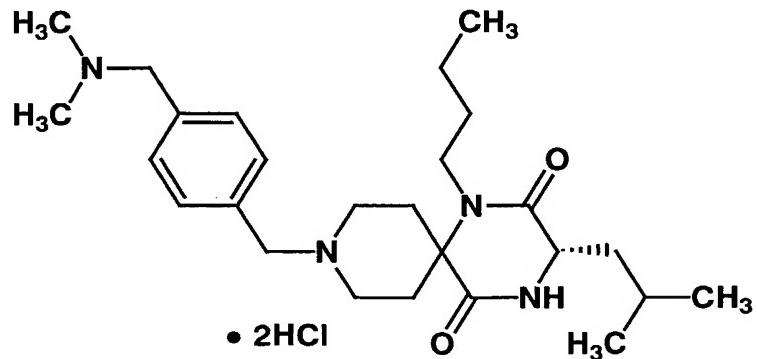


TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10

実施例 37 (54)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ジメチルアミノメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

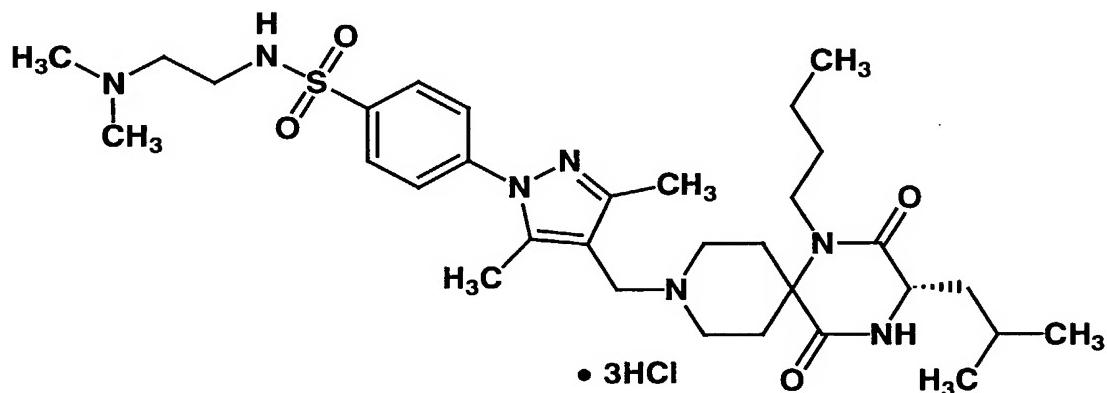


15

TLC : R_f 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.50-3.42 (m, 4H), 2.87 (s, 6H), 2.65-2.50 (m, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 1.88-1.32 (m, 7H), 0.97-5 0.92 (m, 9H)。

実施例 3 7 (5 5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-(2-ジメチルアミノエチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・3塩酸塩

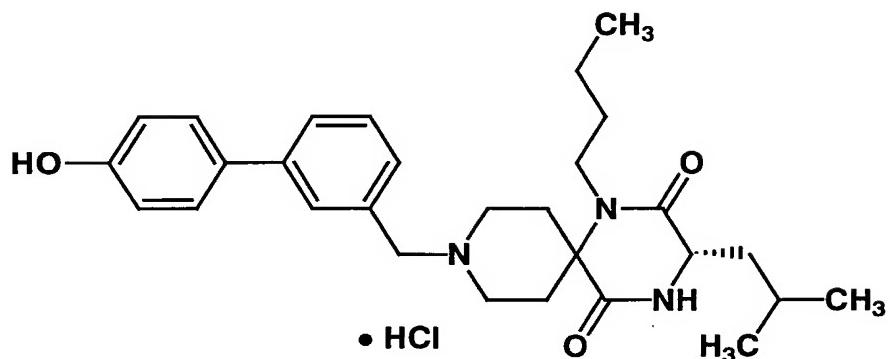


TLC : R_f 0.13 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.68-3.45 (m, 4H), 3.40-3.20 (m, 4H), 2.95 (s, 6H), 2.70-2.50 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.88-1.34 (m, 7H), 0.98-0.92 (m, 9H)。

実施例 3 7 (5 6)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-

9-(3-(4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

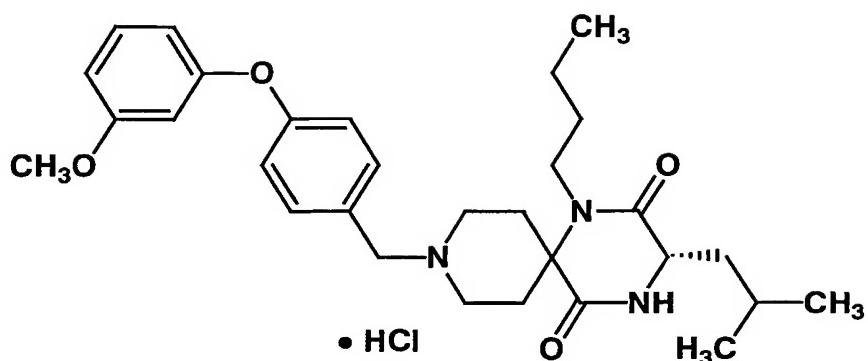


TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.69 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.44-3.30 (m, 2H), 2.53-2.33 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.40 (m, 5H), 1.43-1.25 (m, 2H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 10 3H)。

実施例 37 (5.7)

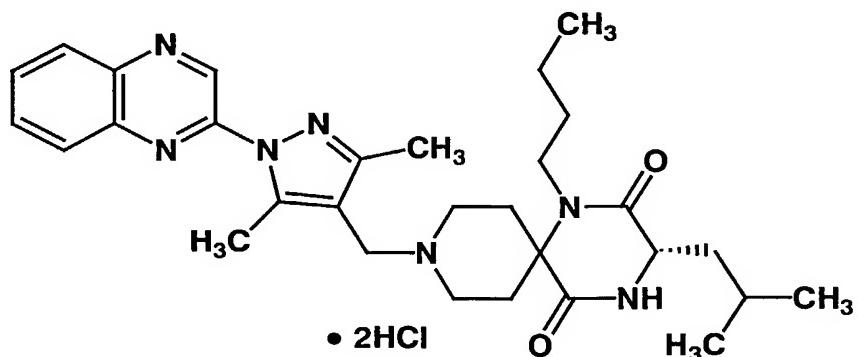
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩
15



TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.28 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.75 (ddd, J = 8.3, 2.3, 1.0 Hz, 1H), 6.60-6.57 (m, 2H), 4.33 (s, 2H),
 5 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.51-3.34 (m, 4H),
 2.41 (m, 2H), 2.42-2.12 (m, 2H), 1.84-1.33 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94
 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 37 (58)

10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 9-(3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール-4-
 イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩
 酸塩

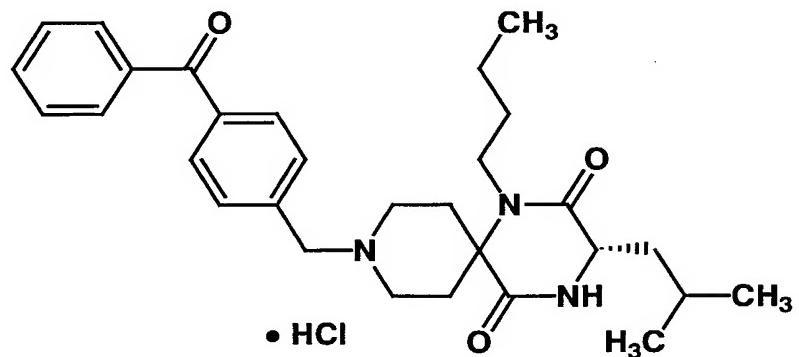


15 TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 9.51 (s, 1H), 8.12 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 8.04 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.90-7.80 (m, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.96-3.81 (m, 2H), 3.63 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 2.29-2.17 (m, 2H), 1.86-1.33 (m, 7H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H),
5 0.94 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (5 9)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルカルボニルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザス
10 ピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

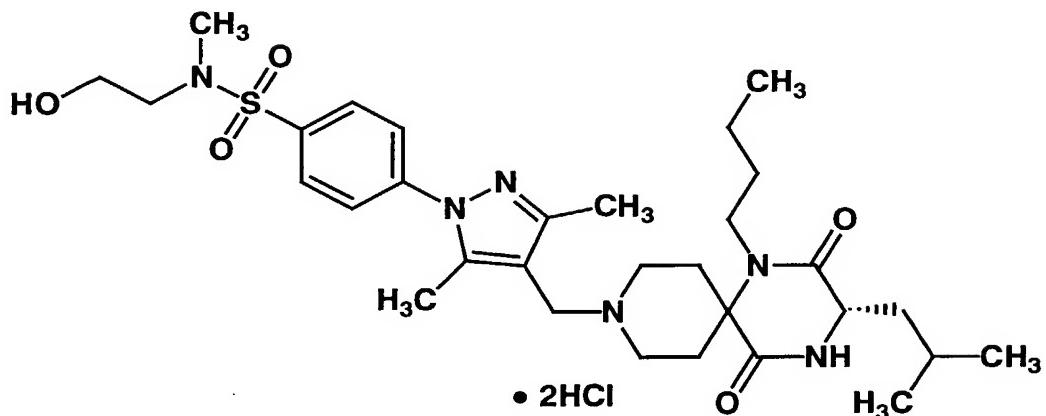


TLC : Rf 0.76 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 7.88 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.81-7.67 (m, 5H), 7.57-7.52 (m, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 8.1, 4.8$ Hz, 1H), 4.00-3.78 (m, 2H), 3.59-3.48 (m, 2H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 1.02-0.88 (m, 9H)。

実施例 3 7 (6 0)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,
20

4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

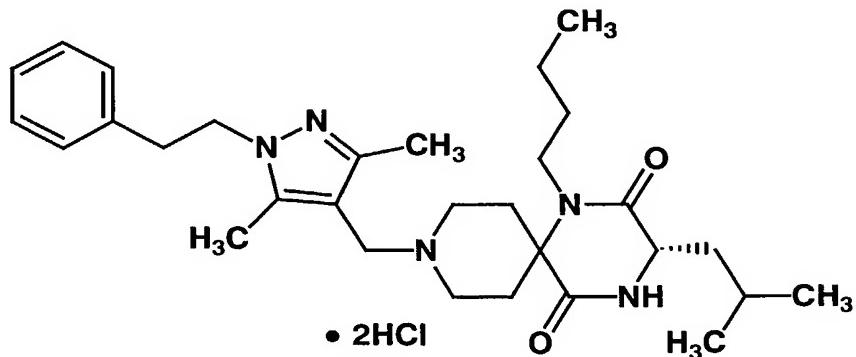


TLC : Rf 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.00 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.76 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.98-3.76 (m, 2H), 3.70 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 3.20 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.97 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

10 実施例 37 (61)

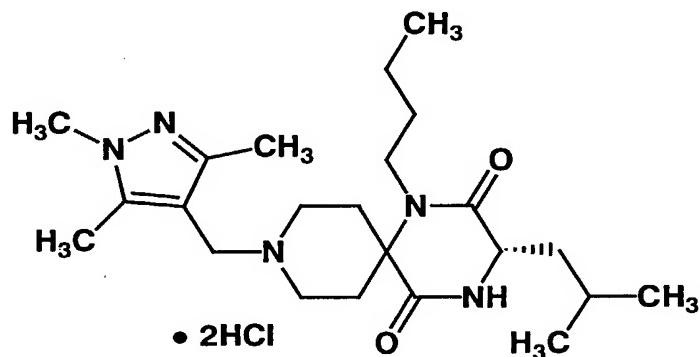
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.31-7.23 (m, 3H), 7.10 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.44 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.21 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.82-3.60 (m, 2H), 3.58-3.32 (m, 4H), 3.13 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.72-2.52 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.90-1.36 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (62)

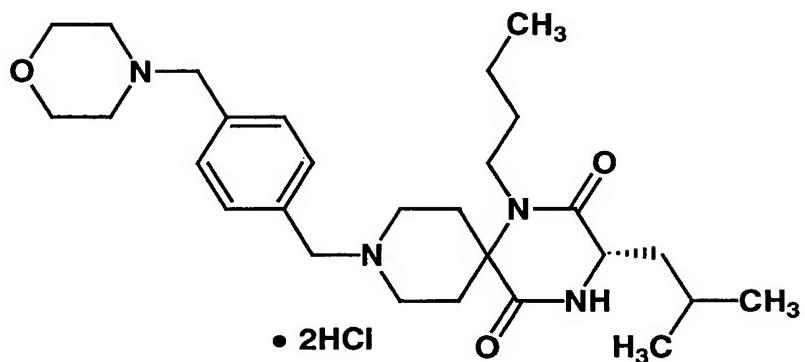
(3S)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.87-3.69 (m, 2H), 3.60-3.43 (m, 4H), 2.69-2.50 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.98-0.85 (m, 9H)。

実施例 37 (63)

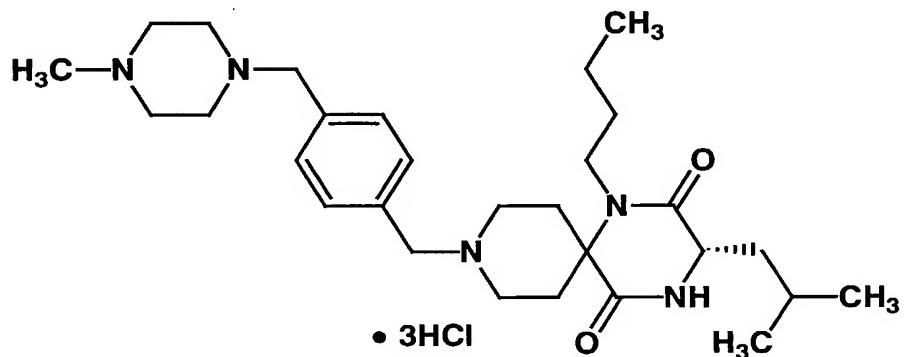
(3S)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 4H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.10-3.70 (m, 6H), 3.54-3.42 (m, 4H), 3.40-5.3.16 (m, 4H), 2.65-2.46 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.88-1.28 (m, 7H), 1.02-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (64)

(3S)-1-(2-methylpropyl)-5-[2-(4-(2-methylpropyl)phenyl)piperidin-1-yl]-3-(4-methylbutyl)azaspiro[5.5]undecan-9-one
 10 - (4-(4-methylpiperidin-1-yl)phenyl)methyl) - 1, 4, 9-triazaspiro[5.5]undecan-3 塩酸塩

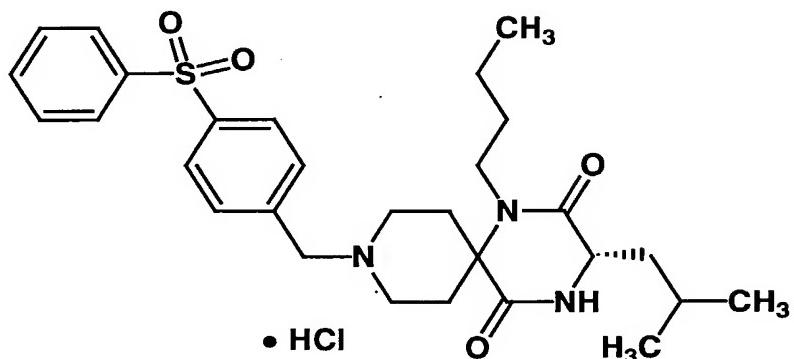


TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.45 (m, 4H), 4.55 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 15 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.56 (m, 10H), 3.53-3.43 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.59-2.47 (m,

2H), 2.22-2.09 (m, 2H), 1.85-1.33 (m, 7H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (6 5)

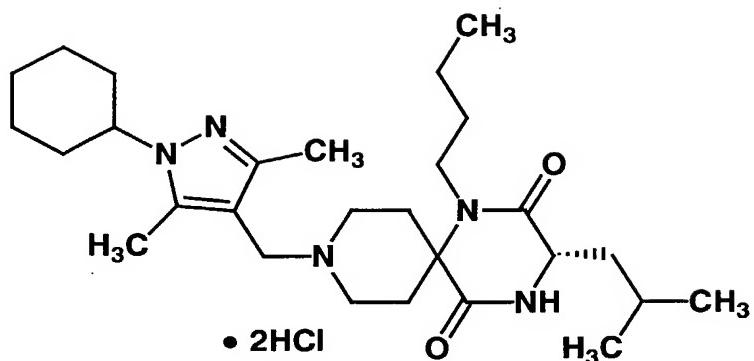
5 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルスルホニルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.70 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;
 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.08 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.02-7.96 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70-7.55 (m, 3H), 4.43 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.91-3.72 (m, 2H), 3.48-3.34 (m, 4H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.88-1.43 (m, 5H), 1.34 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.96-0.90 (m, 9H)。

実施例 3 7 (6 6)

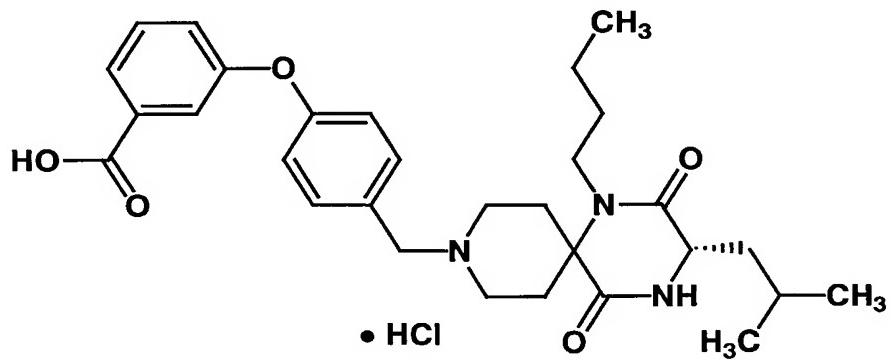
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-シクロヘキシリピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.28 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.35-4.20 (m, 3H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.68
 (m, 2H), 3.58-3.41 (m, 4H), 2.60-2.46 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.26-
 5 2.08 (m, 2H), 1.98-1.26 (m, 17H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (67)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 9-(4-(3-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
 10 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

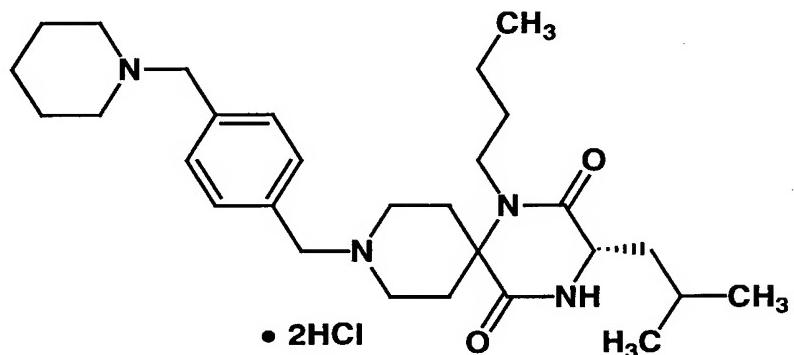


TLC : R_f 0.11 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.83 (ddd, J = 7.8, 1.5, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 2.4, 1.5 Hz,
 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (ddd, J = 7.8, 2.4, 0.9
 15 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),

3.90-3.72 (m, 2H), 3.57-3.36 (m, 4H), 2.50-2.34 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.89-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (68)

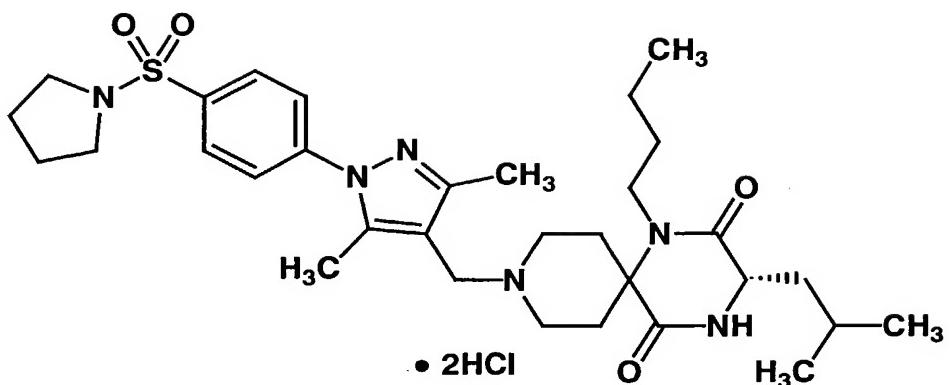
5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



- TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
- 10 NMR (CD_3OD) : δ 7.75 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.65 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.91-3.71 (m, 2H), 3.54-3.41 (m, 6H), 3.05-2.91 (m, 2H), 2.67-2.49 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 2.00-1.28 (m, 13H); 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (69)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-(ピロリジン-1-イルスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

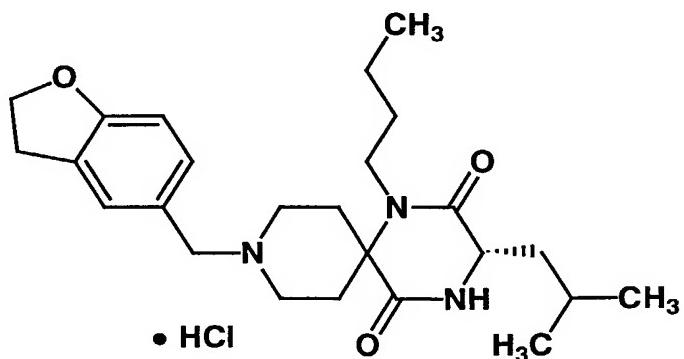


TLC : R_f 0.36 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.50-5.40 (m, 2H), 3.34-3.24 (m, 4H), 2.62-2.47 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30-2.11 (m, 2H), 1.90-1.45 (m, 9H), 1.38 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.00-0.90 (m, 9H).

実施例 37 (70)

10 (3S)-1-(2-methylpropyl)-5-((2-methylpropyl)amino)-2-(1-methyl-1-azabicyclo[4.1.0]hept-5-en-2-yl)-9-(2,3-dihydrobenzofuran-5-il)propan-1-one dihydrochloride



TLC : R_f 0.56 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

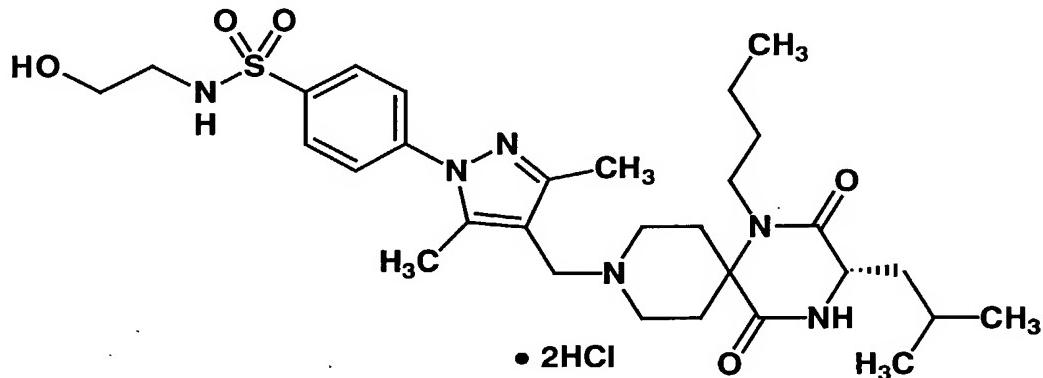
15 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (brs, 1H), 7.26 (dd, J = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1

Hz, 1H), 4.59 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 3.24 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 2.49-2.35 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.89-1.43 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

5

実施例 3 7 (7 1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-(2-ヒドロキシエチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザス
10 ピロ [5.5] ウンデカン・2塩酸塩

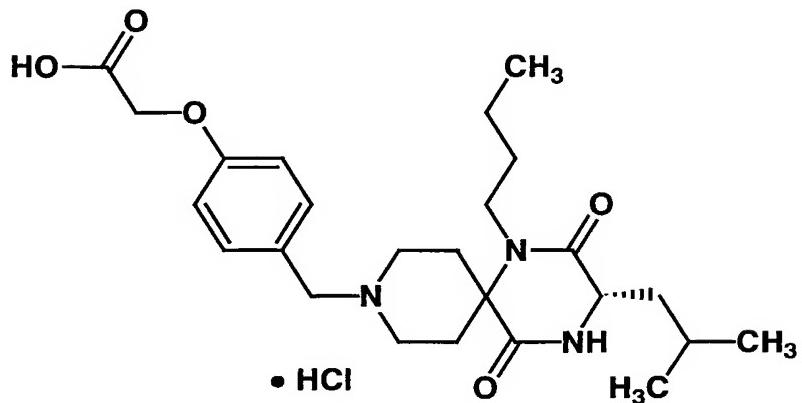


TLC : Rf 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.73 (m, 2H), 3.67-3.57 (m, 2H), 3.56 (t, 15 J = 5.7 Hz, 2H), 3.51-3.40 (m, 2H), 3.01 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.63-2.42 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.92-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 1.00-0.91 (m, 9H)。

実施例 3 7 (7 2)

20 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-

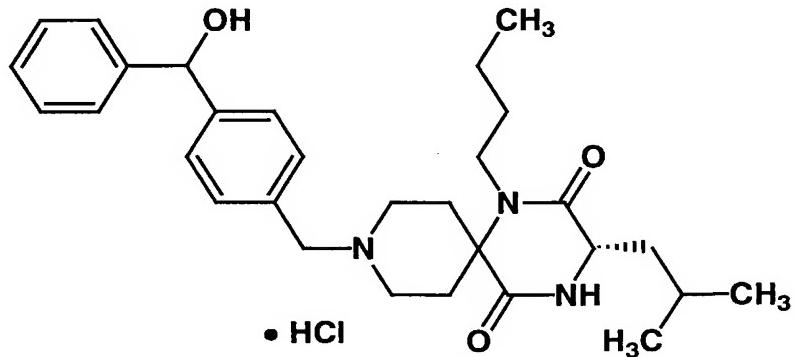
9-(4-(カルボキシメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.71 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.67 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.46-2.28 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.27 (m, 7H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (73)

10 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(1-フェニル-1-ヒドロキシメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



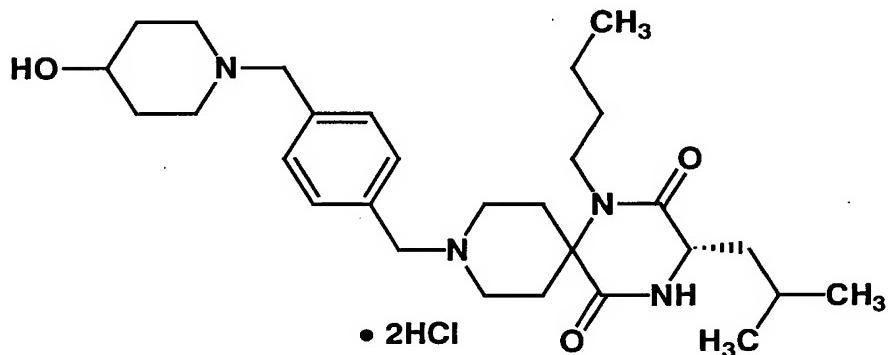
TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.62-7.18 (m, 9H), 5.82 (s, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.00 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48-2.28 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.95 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

5

実施例 3 7 (7 4)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-ヒドロキシペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



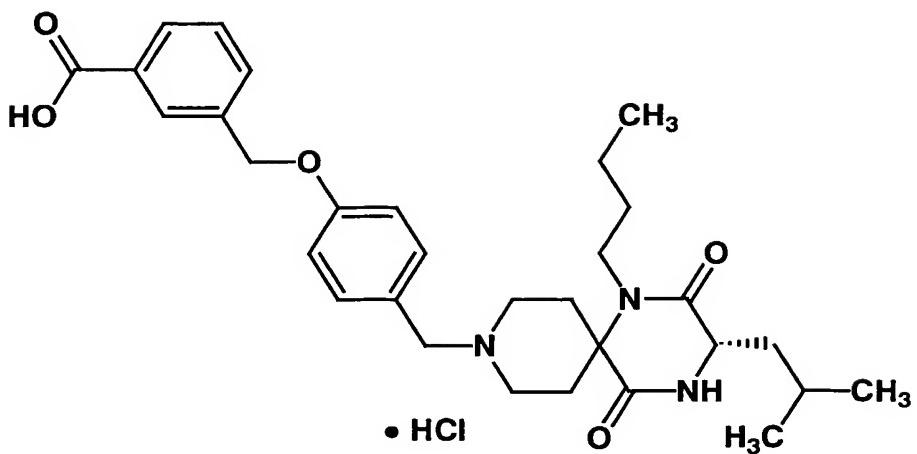
10

TLC : Rf 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.73 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.69-7.61 (m, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.40-4.34 (m, 2H), 4.11-4.05 (m, 1H), 4.00 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.93-3.72 (m, 2H), 3.55-3.38 (m, 4H), 3.16-3.00 (m, 1H), 2.60-2.38 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 3H), 2.00-1.88 (m, 2H), 1.88-1.43 (m, 9H), 1.43-1.14 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 3 7 (7 5)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



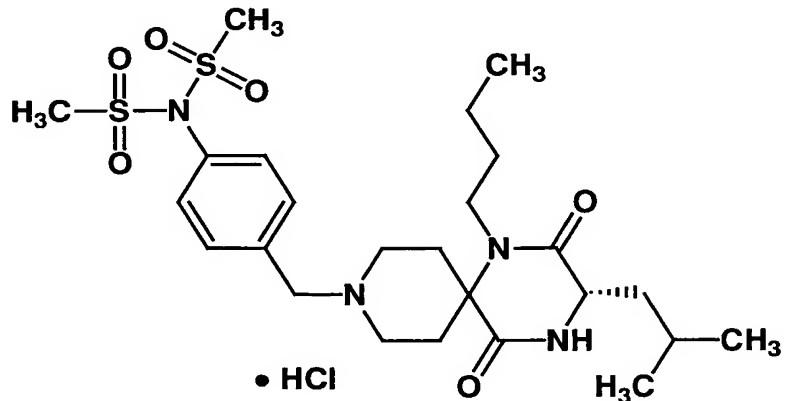
TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.10 (s, 1H), 7.98 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H),

- 5 5.22 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (76)

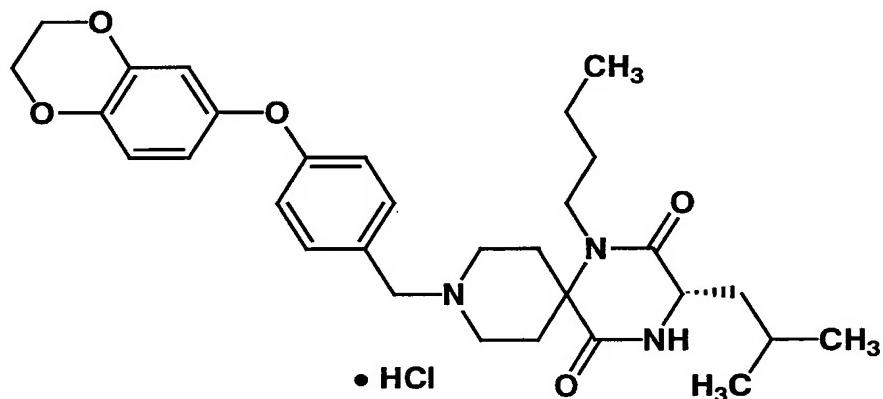
- 10 (3S)-1-(4-(2-(4-(bis(2-methylpropyl)amino)phenyl)undecylidene)-9-(4-(dimethylsulfamoyl)phenyl)triaza[5.5]octane hydrochloride



TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.72 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.44 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 3.47 (s, 6H), 2.50-2.12 (m, 4H), 1.92-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (77)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルオキシ)フェニルメチル)-10-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

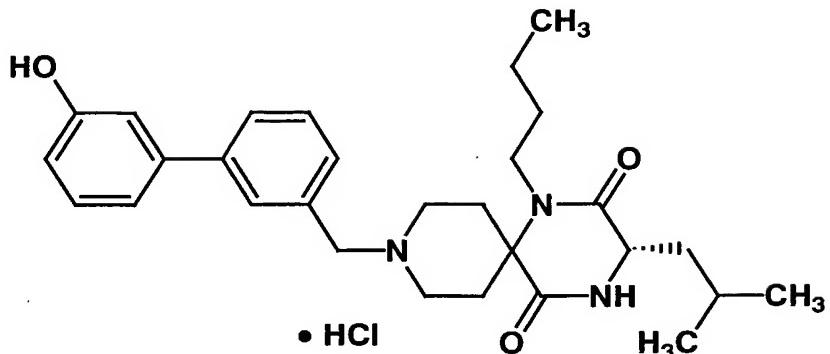


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.85 (m, 1H), 6.55 - 6.51 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.24 (s, 4H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 2H), 3.56-3.32 (m, 4H), 2.42-2.10 (m, 4H), 1.92-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (78)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-(3-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-10,1,4,9-ト

リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.19 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.83 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.59-7.51 (m, 2H), 7.28 (m, 1H),

5 7.16-7.09 (m, 2H), 6.81 (m, 1H), 4.44 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H),

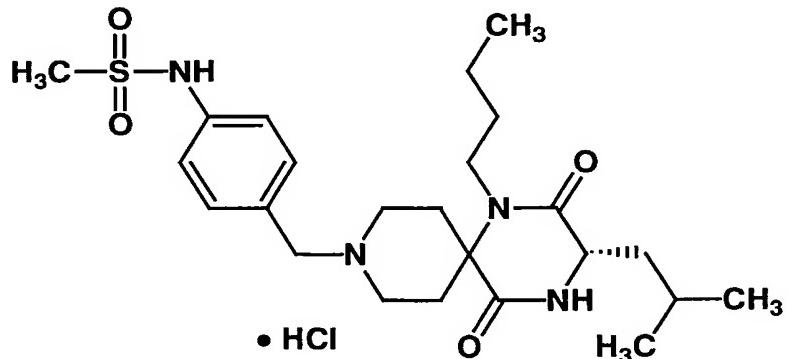
3.94-3.76 (m, 2H), 3.58-3.32 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H),

1.88-1.26 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J =

6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 37 (79)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(メチルスルホニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



15 TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

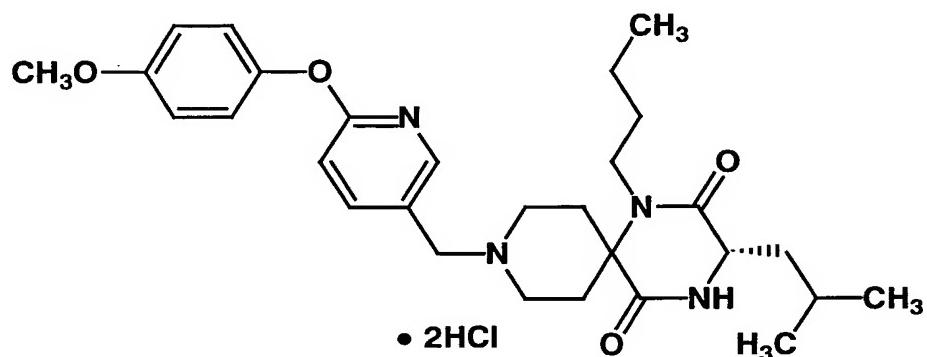
NMR (CD_3OD) : δ 7.52 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.34 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.52-3.14 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.46-2.30 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.88-1.10 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

5

実施例 3 7 (8 0)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(4-メトキシフェニルオキシ)ピリジン-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

10



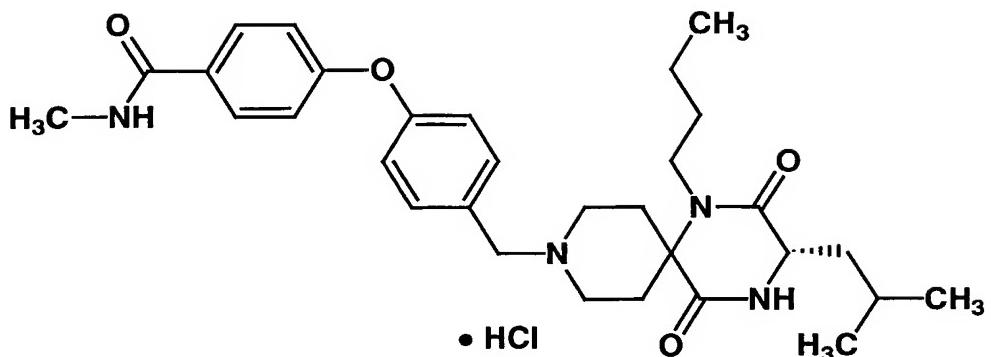
TLC : Rf 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.30 (m, 1H), 8.05 (m, 1H), 7.10-6.86 (m, 5H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.05 (m, 2H), 1.88-1.26 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

15

実施例 3 7 (8 1)

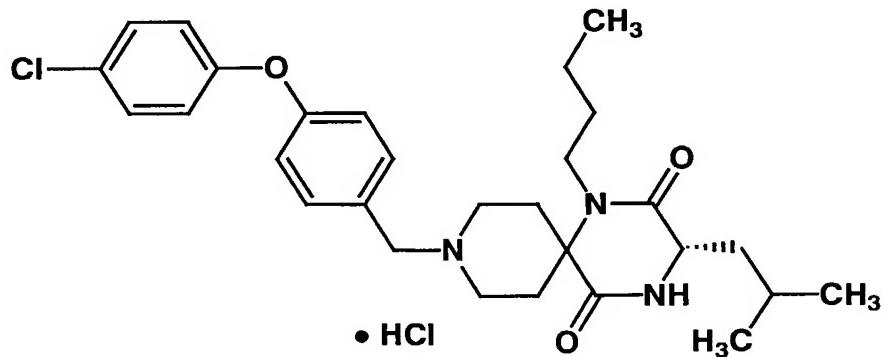
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 8.39 (brd, J = 4.5 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.59 (d,
 5 J = 9.0 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H),
 4.01 (m, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 4H), 2.91 (d, J = 4.5 Hz, 3H),
 2.55-2.30 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H),
 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (82)

10 (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-クロロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

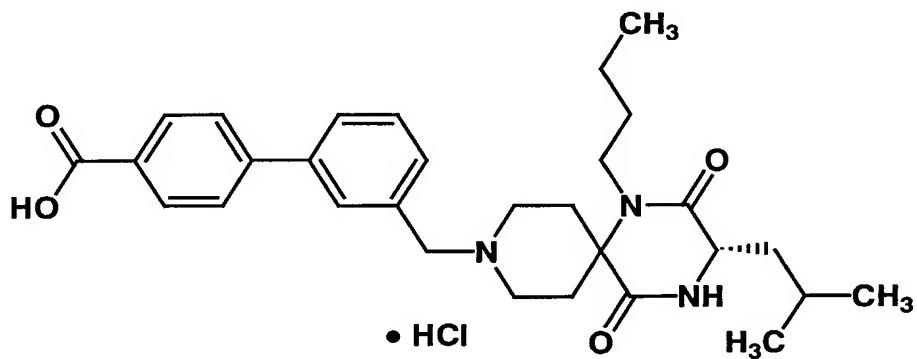


TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08 (d, J

= 8.4 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.60-3.30 (m, 4H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.90-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 3 7 (8 3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

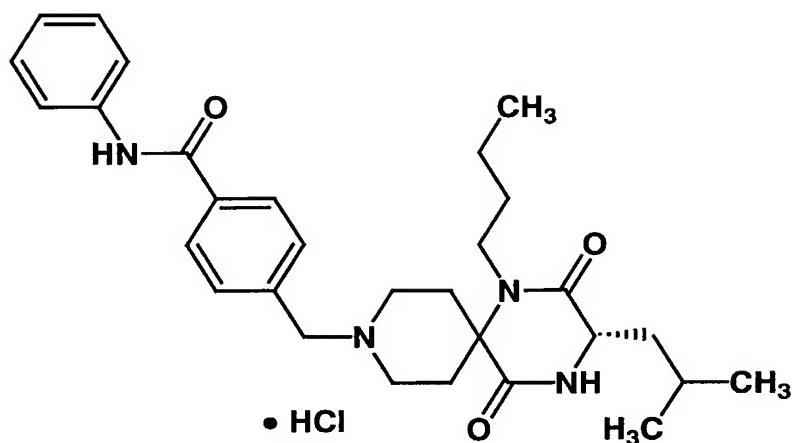


10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.13 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.81 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 4.46 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.48-2.08 (m, 4H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

15

実施例 3 7 (8 4)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(フェニルアミノカルボニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



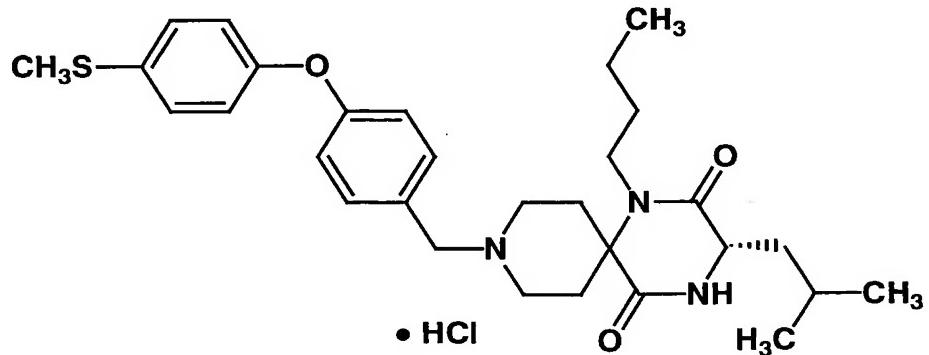
TLC: R_f 0.27 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.74 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.72-7.67

5 (m, 2H), 7.38 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.47 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.76 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.54-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H).

実施例 37 (85)

10 (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(4-メチルチオフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

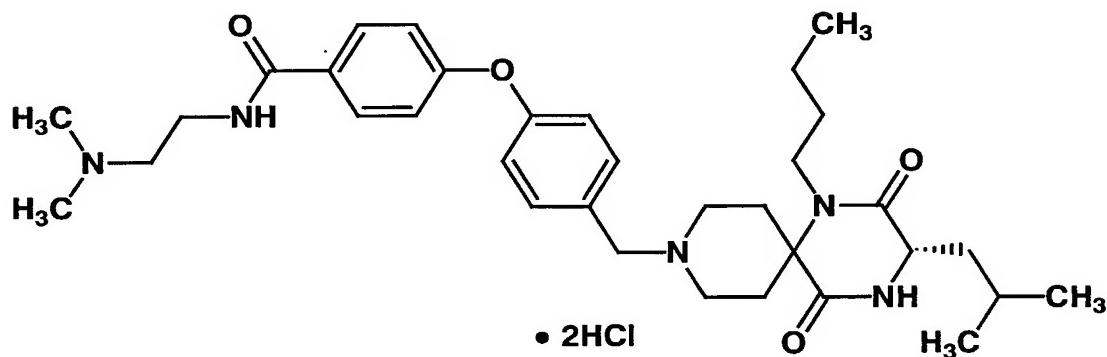


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.33 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.07 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.00 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H),
5 0.94 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H)。

実施例 3 7 (8 6)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニル
10 オキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデ
カン・2 塩酸塩



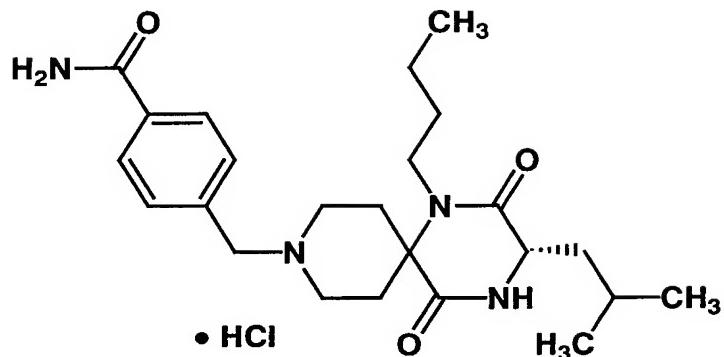
TLC : Rf 0.11 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.93 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.64 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.15 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.10 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H),
15 3.88-3.70 (m, 4H), 3.54-3.36 (m, 6H), 2.98 (s, 6H), 2.62-2.44 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.88-1.30 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 3 7 (8 7)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピ

口 [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

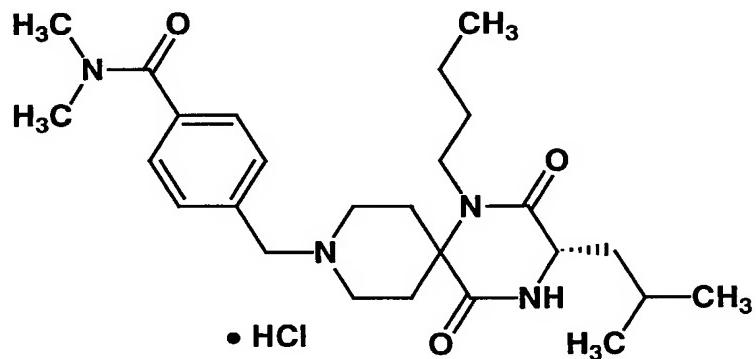


TLC : R_f 0.17 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.88-1.28 (m, 7H), 0.98-0.88 (m, 9H).

実施例 3 7 (8 8)

(3S) - 1 - プチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
10 9 - (4 - ジメチルアミノカルボニルフェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



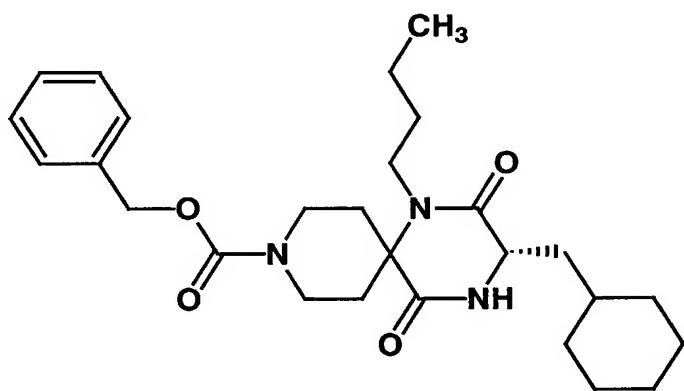
TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.68 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.82 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 3.11 (s,

3H), 2.99 (s, 3H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.86-1.28 (m, 7H), 1.00-0.86 (m, 9H)。

実施例 3 8

5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

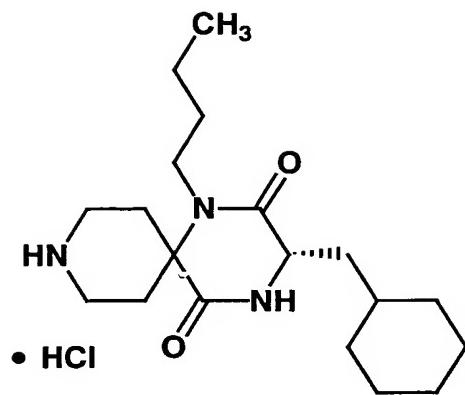


10 N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシンの代わりに、N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-シクロヘキシリルアラニンを用いて、実施例35と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.35 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.39-7.31 (m, 5H), 6.48 (brs, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.15 (brs, 2H), 4.00 (ddd, J = 9.6, 4.8, 1.5 Hz, 1H), 3.76-3.16 (m, 4H), 2.02-1.12 (m, 19H), 1.08-0.88 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 3 9

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



実施例 3 8 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.08 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 90 : 10 : 1) ;

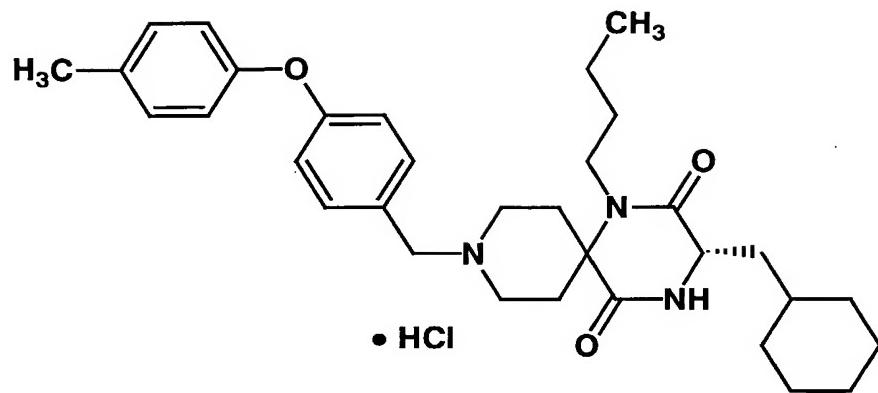
NMR (CD₃OD) : δ 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.46-3.34 (m, 4H), 2.40-2.04 (m, 4H), 1.83-1.46 (m, 10H), 1.39 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.33 - 1.15 (m, 3H), 1.05-0.86 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 4 0 (1) ~ 4 0 (90)

実施例 3 9 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 4 0 (1)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリルメチル - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

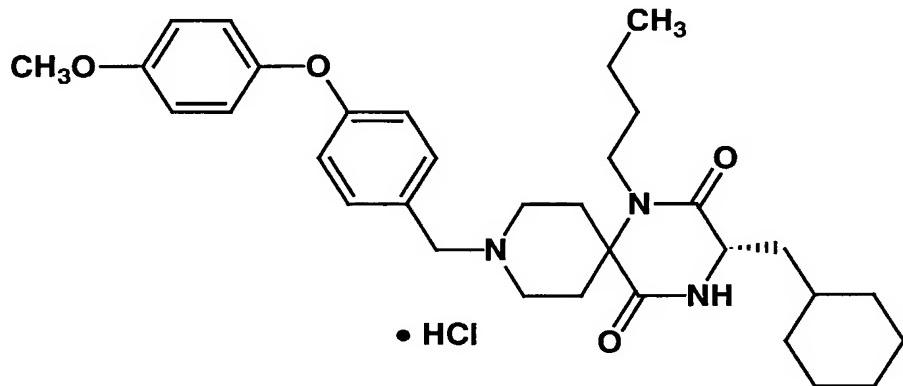


TLC : R_f 0.71 (酢酸エチル) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.19 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.87-3.69 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.49-2.30 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.05-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (2)

10 (3S)-1-(4-(4-methoxyphenyl)phenyl)-5-oxo-3-azabicyclo[5.5.0]decane-9-
 - (4-(4-methoxyphenyl)phenyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-5-carboxylic acid cyclohexylmethyl ester hydrochloride



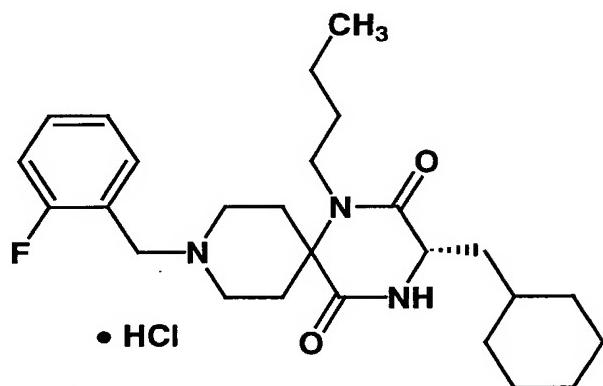
TLC : R_f 0.67 (酢酸エチル) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.49 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.02-6.92 (m, 6H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.54-3.30 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.05-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5

実施例 4 0 (3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-
 -(2-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
 ウンデカン・塩酸塩



10

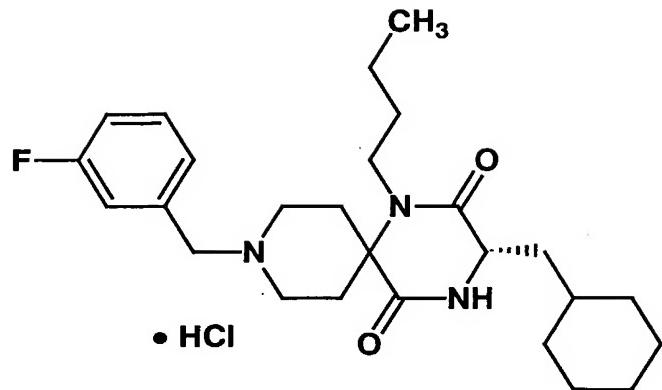
TLC : Rf 0.38 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.70-7.53 (m, 2H), 7.38-7.23 (m, 2H), 4.44 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.95-3.77 (m, 2H), 3.60-3.45 (m, 2H), 3.45-3.30 (m, 2H), 2.53-2.34 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.05-0.82 (m, 2H), 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 4 0 (4)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-
 -(3-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]

20 ウンデカン・塩酸塩

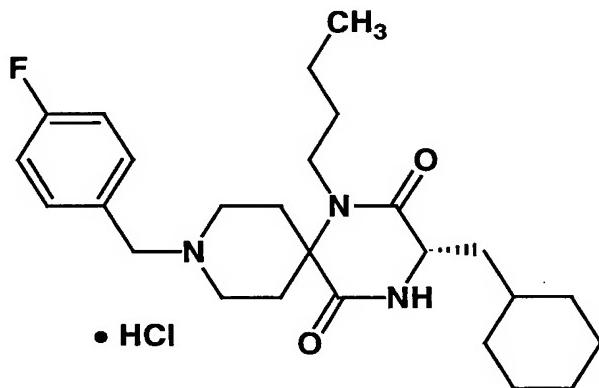


TLC : R_f 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57-7.48 (m, 1H), 7.44-7.37 (m, 2H), 7.30-7.21 (m, 1H),
 4.38 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.55-3.33 (m, 4H),
 5 2.56-2.37 (m, 2H), 2.25-2.04 (m, 2H), 1.82-1.08 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H),
 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9
 10 - (4-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ [5.5]
 ウンデカン・塩酸塩



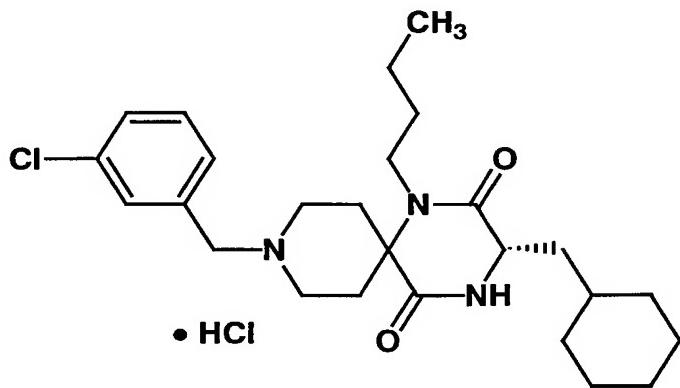
TLC : R_f 0.27 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.62 (dd, J = 8.7, 5.1 Hz, 2H), 7.23 (dd, J = 8.7, 8.7 Hz, 2H),

4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.88-3.71 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.27-2.04 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.05-0.82 (m, 2H), 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5 実施例 4 0 (6)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（3-クロロフェニルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

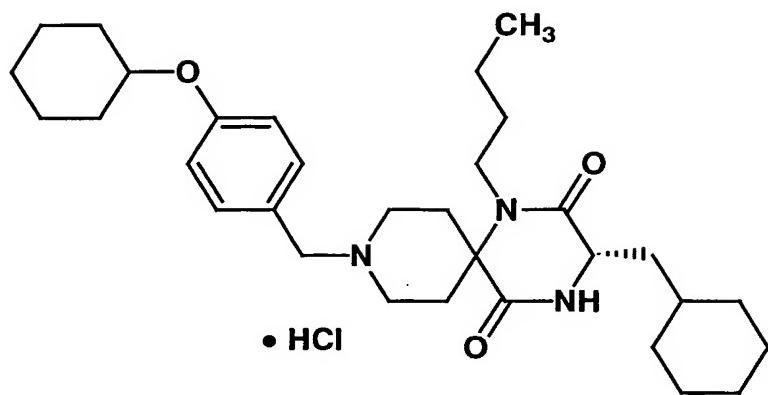


10 TLC : R_f 0.60 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.65 (m, 1H), 7.55-7.49 (m, 3H), 4.37 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.0, 4.5$ Hz, 1H), 3.83 (m, 2H), 3.54-3.47 (m, 2H), 3.41-3.35 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.78-1.47 (m, 9H), 1.42-1.17 (m, 6H), 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.97-0.92 (m, 2H)。

15

実施例 4 0 (7)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリオキシフェニルメチル-9-（4-シクロヘキシリオキシフェニルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

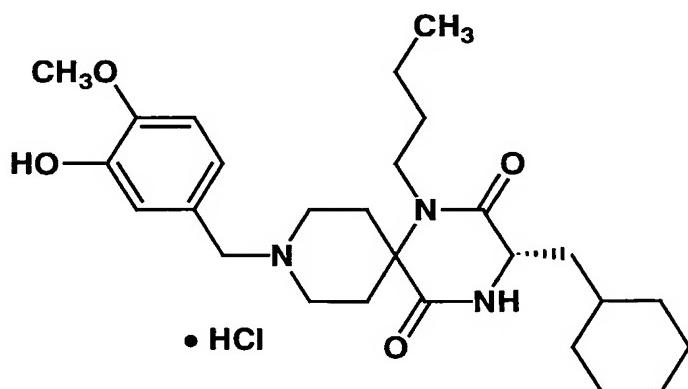


TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (m, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.65 (m, 2H), 3.50-3.30 (m, 4H), 2.42-2.25 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.02-1.92 (m, 2H), 1.84-1.14 (m, 23H), 1.04-0.89 (m, 5H).

実施例 40 (8)

(3S)-1-(ブチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
10-(4-メトキシ-3-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリア
ザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



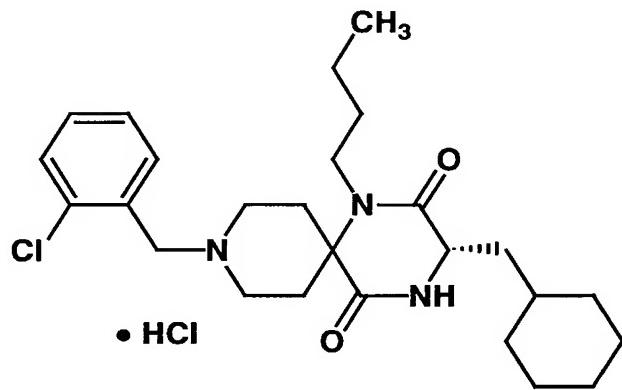
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.01 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.99-6.93 (m, 2H), 4.22 (s, 2H),

4.03 (dd, $J = 7.5, 4.8$ Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.83-3.67 (m, 2H), 3.52-3.42 (m, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.44-2.27 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.89 (m, 5H)。

5 実施例 4 0 (9)

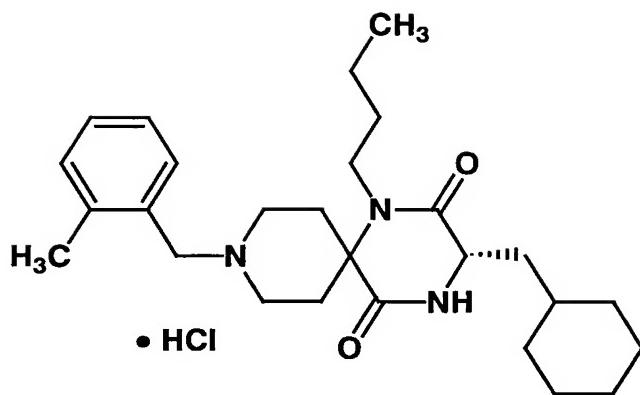
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（2-クロロフェニルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.77 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.69 (dd, $J = 7.5, 2.1$ Hz, 1H), 7.60 (dd, $J = 7.5, 2.1$ Hz, 1H), 7.51 (dt, $J = 2.1, 7.5$ Hz, 1H), 7.47 (dt, $J = 2.1, 7.5$ Hz, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 4.00-3.82 (m, 2H), 3.60-3.48 (m, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.48-2.29 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H), 1.83-1.44 (m, 10H), 1.43-1.12 (m, 5H), 15 1.04-0.88 (m, 5H)。

実施例 4 0 (10)

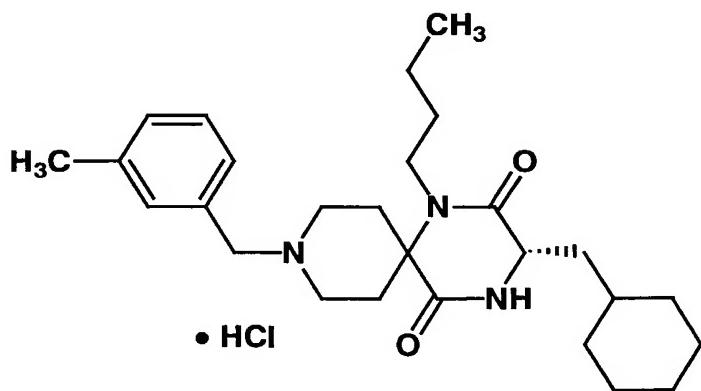
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（2-メチルフェニルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.77 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.56 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.41-7.30 (m, 3H), 4.41 (s, 2H),
 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.79 (m, 2H), 3.57-3.48 (m, 2H), 3.44-3.39 (m,
 5 2H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.82-1.15 (m, 15H),
 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (11)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 10 - (3-メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

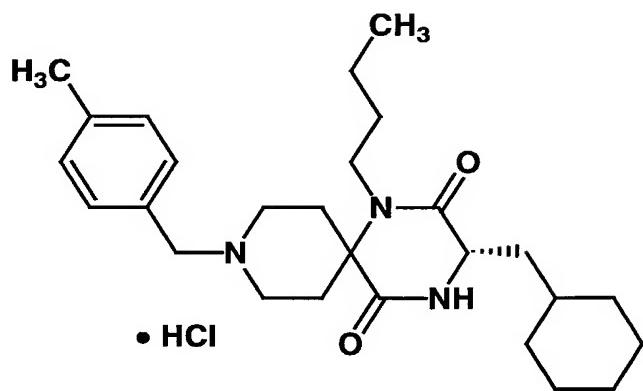


TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz,

1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.52-3.46 (m, 4H), 2.51-2.30 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 4 0 (1 2)

5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
ウンデカン・塩酸塩

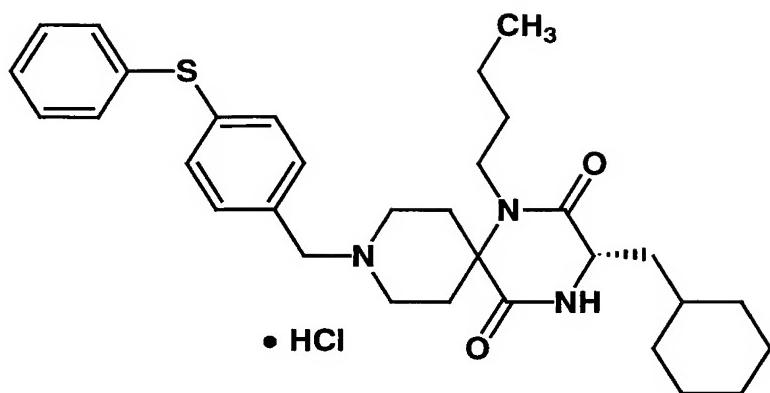


TLC : Rf 0.61 (クロロホルム : メタノール = 1:0 : 1) ;

10 NMR (CD_3OD) : δ 7.44 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.31 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.81-1.10 (m, 15H), 1.04-0.82 (m, 5H)。

実施例 4 0 (1 3)

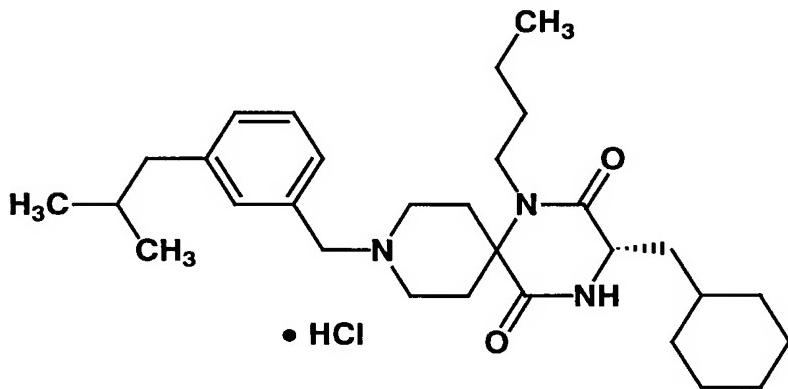
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.74 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.50-7.37 (m, 7H), 7.29 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H),
 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.50-3.32 (m, 4H), 2.56-2.38 (m,
 5 2H), 2.24-2.05 (m, 2H), 1.81-1.06 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (14)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 - (3-(2-メチルプロピル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 10 スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

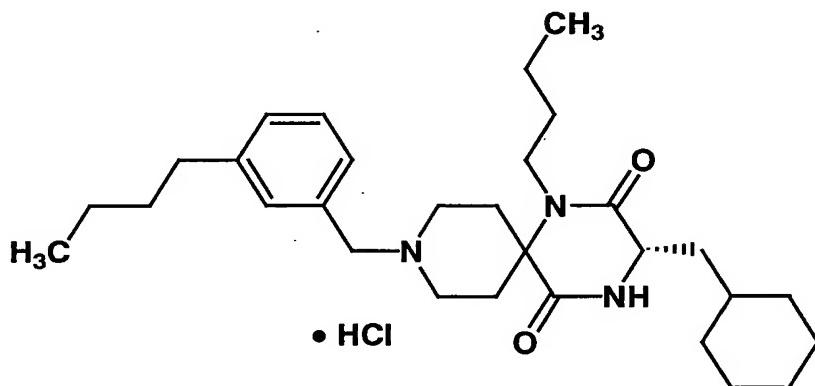


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 4.32 (s,
 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.52 (d, J =

7.2 Hz, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.96-1.14 (m, 16H), 0.97-0.89 (m, 11H)。

実施例 40 (15)

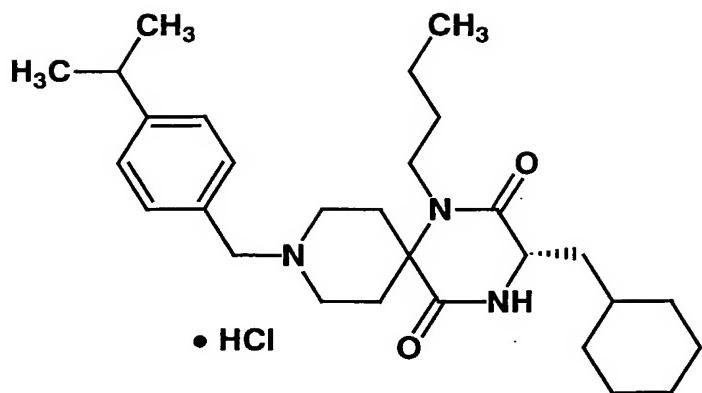
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
5-(3-ブチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s,
10 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.66 (t, J =
7.5 Hz, 2H), 2.41 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.82-1.20 (m, 19H), 1.00-0.89 (m, 2H),
0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (16)

15 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
- (4-イソプロピルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン・塩酸塩



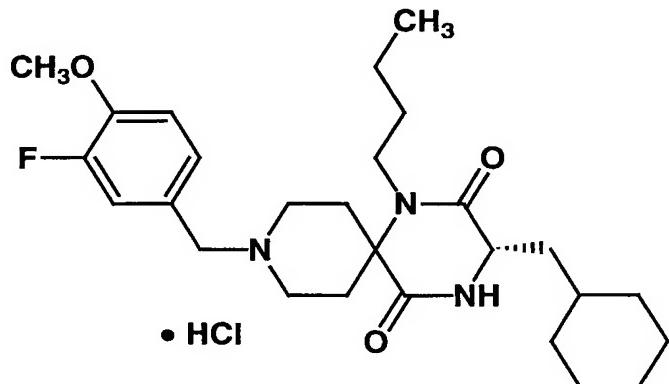
TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s,

2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.74 (m, 2H), 3.52-3.43 (m, 2H), 3.43-
5 3.32 (m, 2H), 3.02-2.90 (m, 1H), 2.45-2.25 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-
1.12 (m, 21H), 1.04-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (17)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
10 - (4-メトキシ-3-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



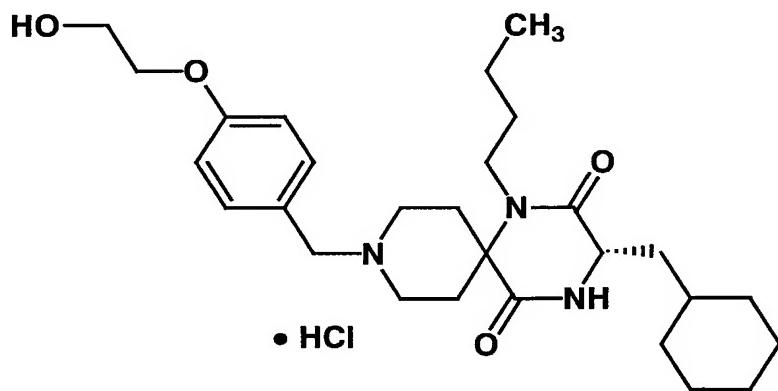
TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.31 (m, 2H), 7.22-7.17 (m, 1H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd,

$J = 7.8, 4.8 \text{ Hz}, 1\text{H}$, 3.90 (s, 3H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.05 (m, 2H), 1.80-1.15 (m, 15H), 1.01-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (18)

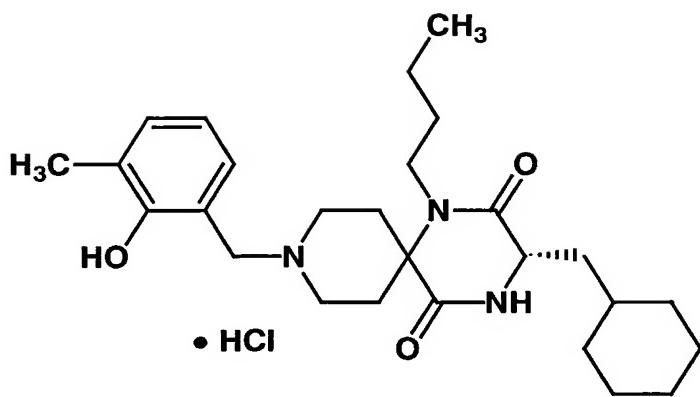
5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
10 NMR (CD_3OD) : δ 7.47 (d, $J = 8.7 \text{ Hz}$, 2H), 7.06 (d, $J = 8.7 \text{ Hz}$, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.08-4.00 (m, 3H), 3.89-3.84 (m, 2H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (19)

15 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
(2-ヒドロキシ-3-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザ
スピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.85 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.30-7.21 (m, 2H), 6.88 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.03

(dd, J = 7.8, 4.2 Hz, 1H), 3.94-3.78 (m, 2H), 3.56-3.46 (m, 2H), 3.42-3.32 (m,

5 2.50-2.30 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.01 (m, 15H),

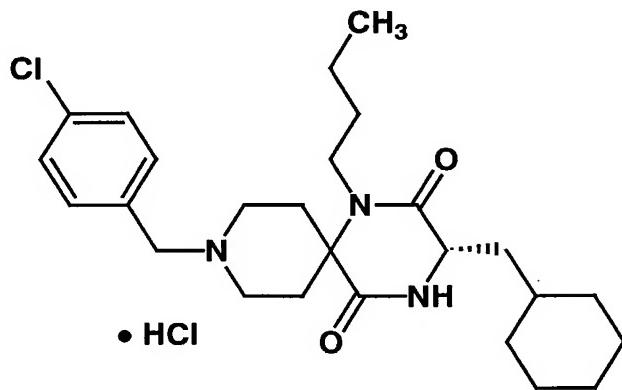
1.00-0.87 (m, 5H)。

実施例 40 (20)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9

10 - (4-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]

ウンデカン・塩酸塩



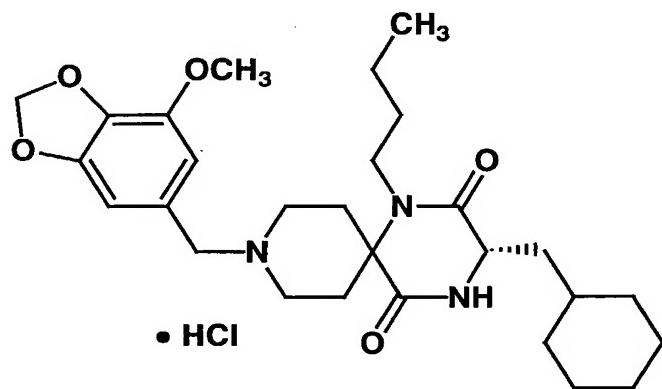
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s,

2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.89-3.71 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.06 (m, 15H), 1.04-0.84 (m, 2H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

5 実施例 4 0 (2 1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9- (7-メトキシ-1,3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

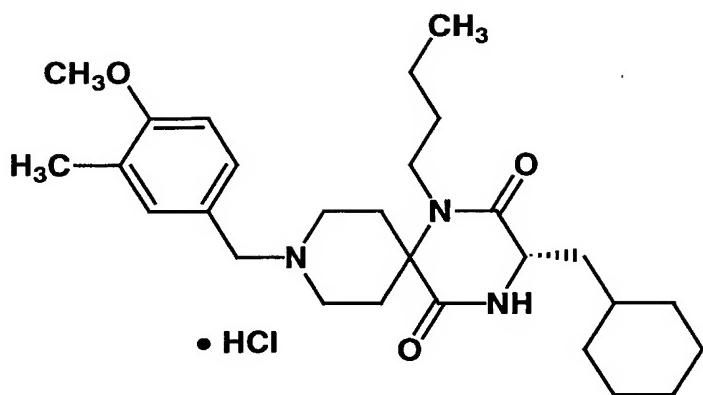


- 10 TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 6.85 (s, 1H), 6.74 (s, 1H), 5.99 (s, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.87-3.67 (m, 2H), 3.54-3.34 (m, 4H), 2.53-2.30 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15

実施例 4 0 (2 2)

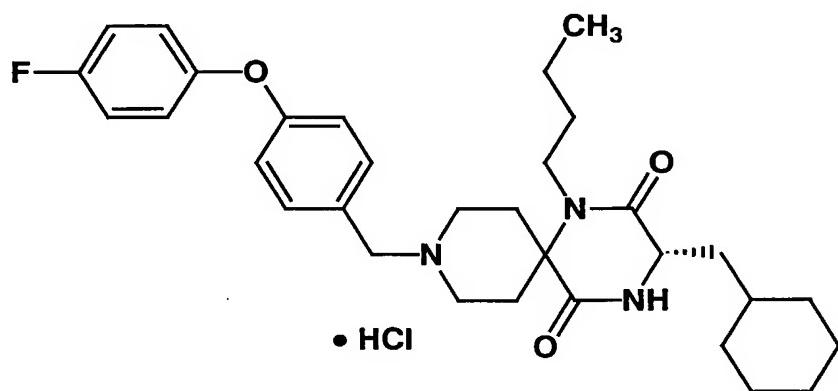
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9- (3-メチル-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.37-7.28 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (s, 2H),
 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.52-3.32 (m, 4H),
 5 2.48-2.28 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.22-2.05 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.06-0.83
 (m, 2H), 0.94 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

実施例 40 (23)

(3S)-1-(4-(4-(4-フルオロフェニルオキシ)フェニルメチル)-2,4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

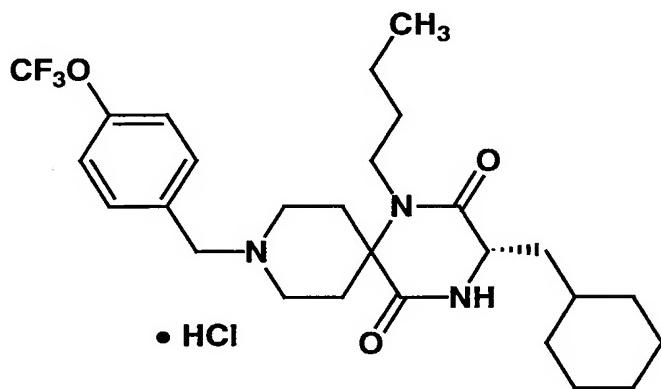


TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18-7.00 (m, 6H), 4.33 (s, 2H),

4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.87-3.69 (m, 2H), 3.55-3.32 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5 実施例 4 0 (2 4)

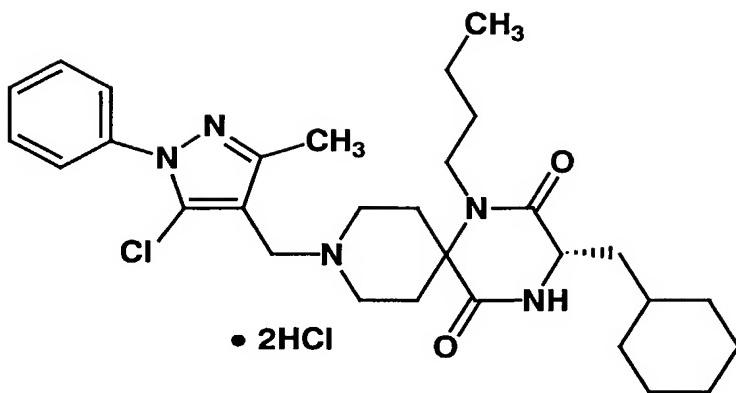
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（4-トリフルオロメトキシフェニルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.72-7.69 (m, 2H), 7.41 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.75 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

15 実施例 4 0 (2 5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（3-メチル-5-クロロ-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.56-7.50 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz,

1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.70-3.59 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 2.60-2.38 (m, 2H),

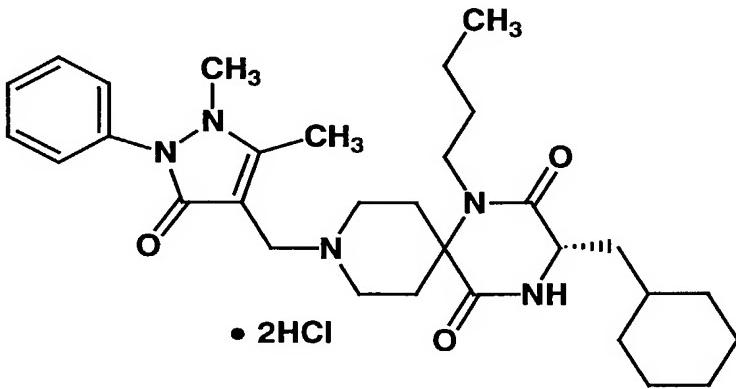
5 2.45 (s, 3H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (26)

(3S)-1-(2-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-

- (2,3-ジメチル-5-オキソ-1-フェニルピラゾリン-4-イルメ

10 チル)-1,4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

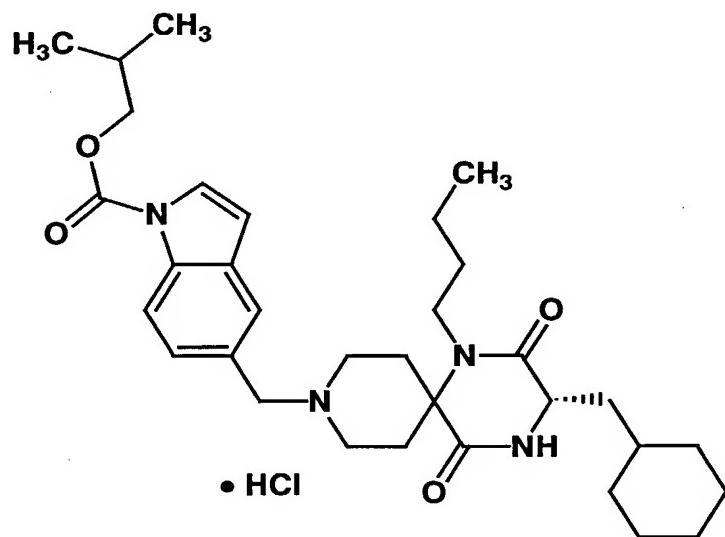
NMR (CD₃OD) : δ 7.62-7.48 (m, 3H), 7.44-7.38 (m, 2H), 4.13 (s, 2H), 4.04 (dd,

J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.64-3.52 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H),

3.35 (s, 3H), 2.60-2.40 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (27)

5 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-((1-(2-メチルプロピルオキシカルボニル)インドール-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



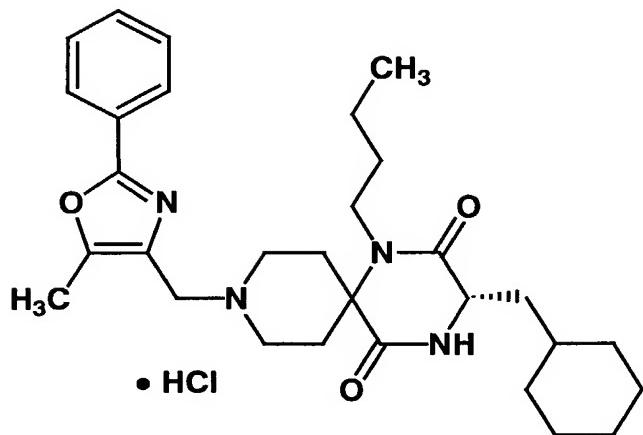
TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.76 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.44 (s, 2H), 4.25 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 3H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.07 (d, J = 9.0 Hz, 6H), 1.00-0.84 (m, 5H)。

15

実施例 40 (28)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-((5-メチル-2-フェニルオキサゾール-4-イルメチル)-1,4,

9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

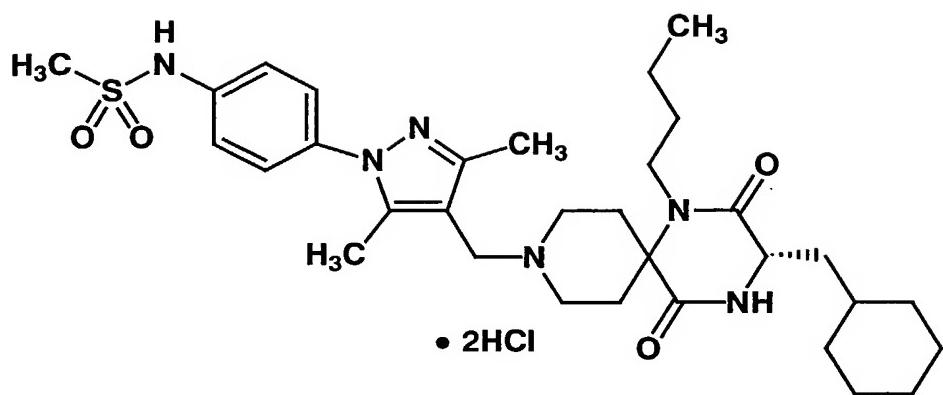


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.04-8.00 (m, 2H), 7.51-7.49 (m, 3H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.70-3.60 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.50-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (29)

10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルスルホニルアミノフェニル) ピラ
ゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
カン・2 塩酸塩

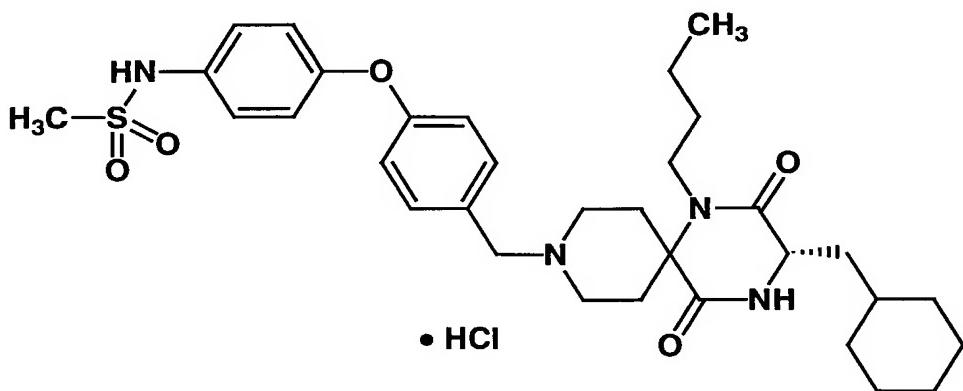


TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.65-3.58 (m, 2H), 3.52-5.45 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.64-2.50 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.00-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (30)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-10-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



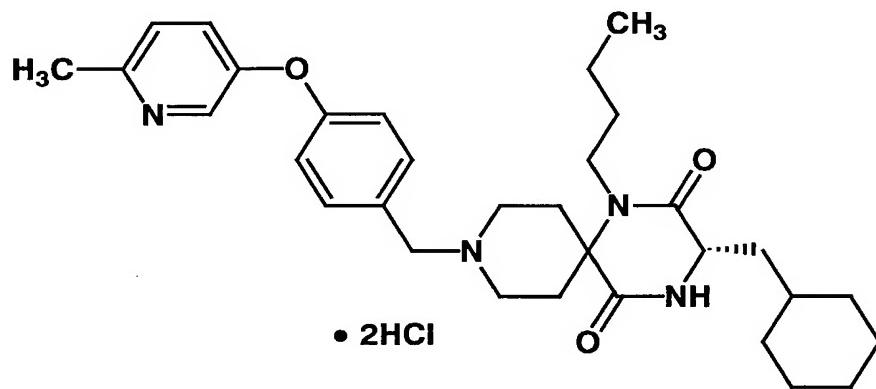
TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08-7.00

(m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.85-3.72 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.95 (s, 3H), 2.48-2.34 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-1.14 (m, 15H), 0.98-0.88 (m, 5H)。

5 実施例 4 0 (3 1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(6-メチルピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1,
4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

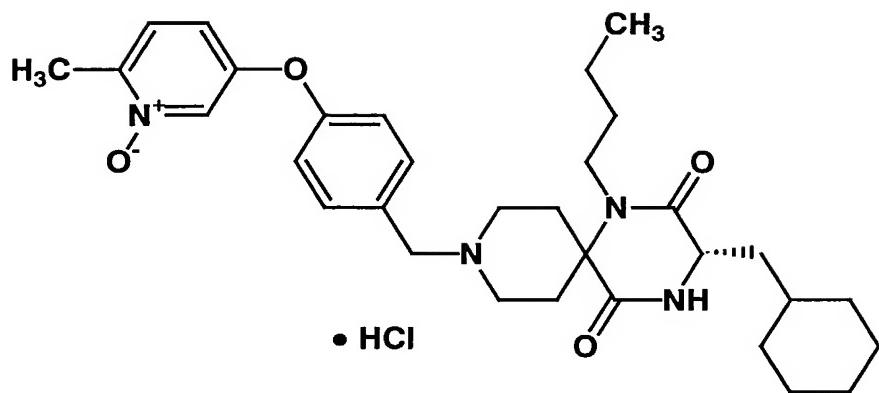


10 TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 8.58 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.17 (m, 1H), 7.90 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 4 H), 2.76 (s, 3H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

15

実施例 4 0 (3 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(6-メチルピリジン-1-オキシド-3-イルオキシ)フェニル
メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

¹H NMR (CD_3OD): δ 8.40 (m, 1H), 7.69 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.69 (m, 1H), 7.54 (m,

1H), 7.27 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.88-

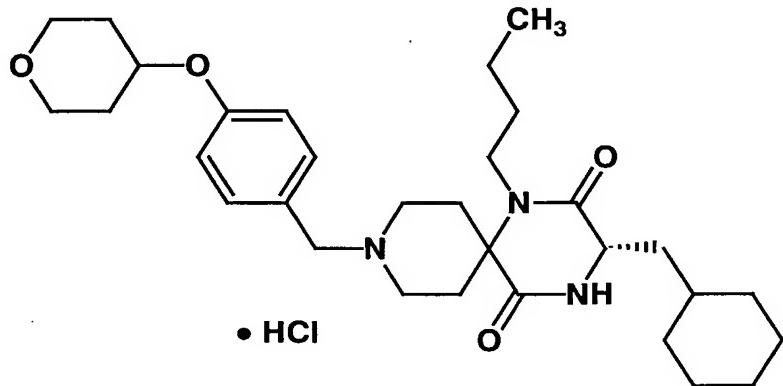
5 3.72 (m, 2H), 3.58-3.39 (m, 4H), 2.59 (s, 3 H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例40（33）

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9

10 - (4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1,

4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



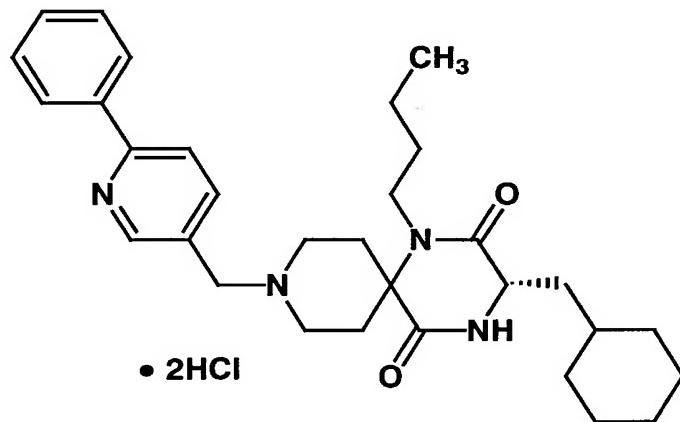
TLC: R_f 0.48 (クロロホルム:メタノール=10:1);

¹H NMR (CD_3OD) : δ 7.49 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.05 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.63 (m,

1H), 4.27 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.62-3.52 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 3H), 2.54-2.38 (m, 2H), 2.22-1.98 (m, 4H), 1.80-1.10 (m, 18H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

5 実施例40(34)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（6-フェニルピリジン-3-イルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

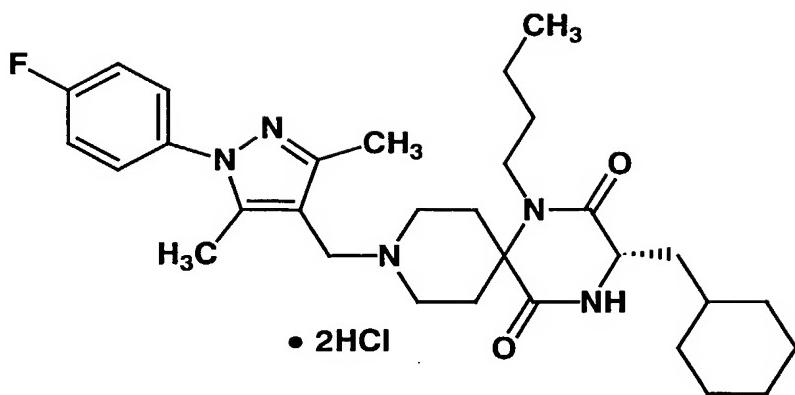


10 TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.14 (m, 1H), 8.75 (m, 1H), 8.36 (m, 1H), 8.02-7.99 (m, 2H), 7.68-7.62 (m, 3H), 4.63 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.02-3.94 (m, 2H), 3.64-3.42 (m, 4H), 2.72-2.56 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

15

実施例40(35)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-（3,5-ジメチル-1-（4-フルオロフェニル）ピラゾール-4-イルメチル）-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.58-7.50 (m, 2H), 7.37-7.28 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd,

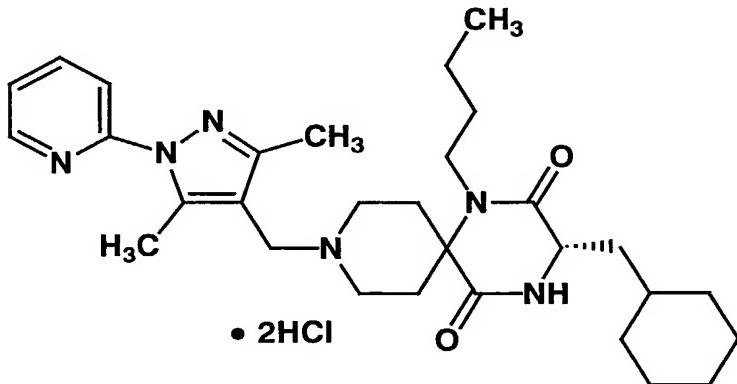
J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.67-3.55 (m, 2H), 3.53-3.42 (m, 2H),

5 2.70-2.48 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.84-1.10 (m, 15H), 1.08-0.93 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (36)

(3S)-1-(2-(2,5-dimethyl-1-(2-pyridyl)-1-((2-pyridylmethyl)amino)-4-oxo-4-azabicyclo[3.1.0]hex-3-ylmethyl)-2-(cyclohexylmethyl)-4-methyl-1,2-dihydro-1,2-dimethyl-3H-pyrazole-3-carboxamide dihydrochloride

10 - (3, 5-dimethyl-1-(2-pyridyl)-1-((2-pyridylmethyl)amino)-4-oxo-4-azabicyclo[3.1.0]hex-3-ylmethyl)-1,4,9-triazaaspiro[5.5]undecan-2 塩酸塩



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.53 (dd, J = 4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.11-8.00 (m, 1H), 7.84 (d, J

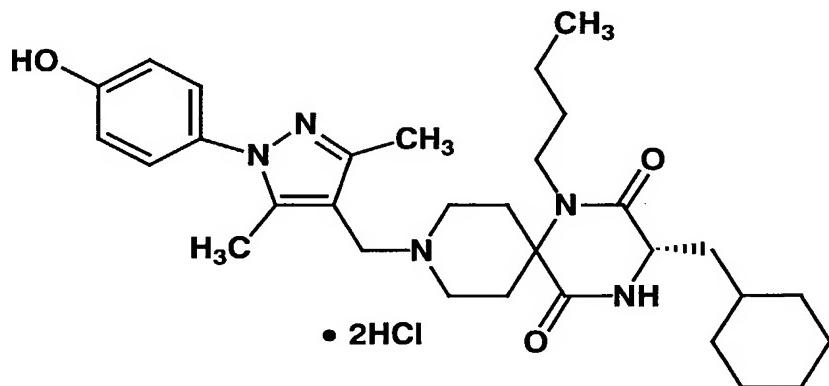
= 8.4 Hz, 1H), 7.49-7.41 (m, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 3.95-3.74 (m, 2H), 3.66-3.54 (m, 2H), 3.50-3.37 (m, 2H), 2.68 (s, 3H), 2.64-2.40
 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.08-0.92 (m, 2H),
 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 4 0 (3 7)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 -(3,5-ジメチル-1-(4-ヒドロキシフェニル)ピラゾール-4-
 イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸

10 塩



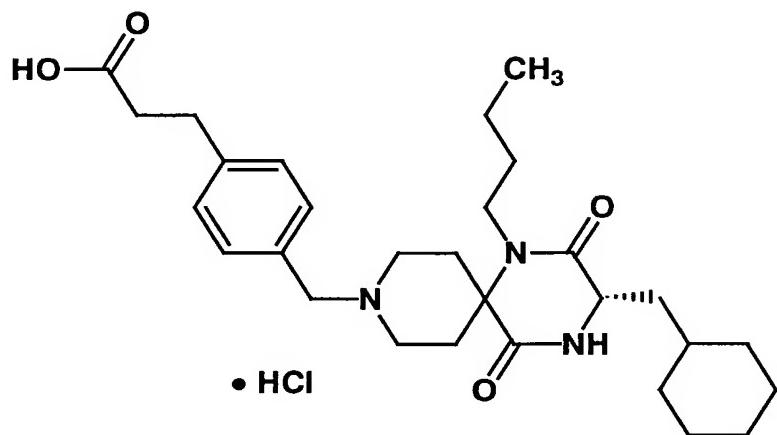
TLC : Rf 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.96 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H),
 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.78 (m, 2H), 3.64-3.61 (m, 2H), 3.50 (t, J =
 8.0 Hz, 2H), 2.68-2.56 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.25-2.12 (m, 2H),
 1.81-1.19 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.99-0.91 (m, 2H)。

実施例 4 0 (3 8)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-

－（4－（2－カルボキシエチル）フェニルメチル）－1，4，9－トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

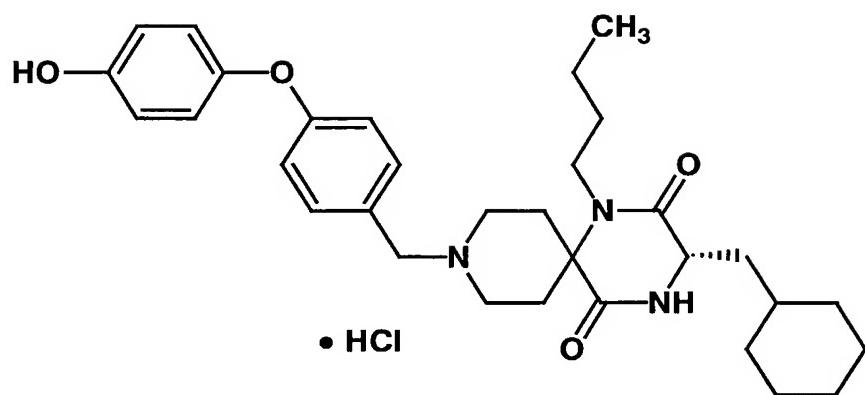


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 2H), 3.50-3.46 (m, 2H), 3.40-3.35 (m, 2H), 2.96 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.42-2.30 (m, 2H), 2.34-2.10 (m, 2H), 1.78-1.18 (m, 15H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (m, 2H).

10 実施例 40 (39)

(3S)－1－ブチル－2，5－ジオキソ－3－シクロヘキシリメチル－9－（4－（4－ヒドロキシフェニルオキシ）フェニルメチル）－1，4，9－トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

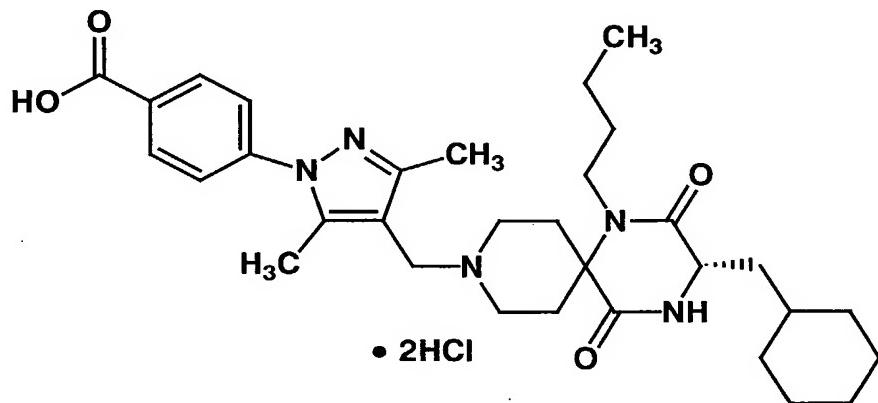


TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.97 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.83-3.72 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 2.23-2.10 (m, 2H), 1.78-1.16
 (m, 15H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例40(40)

(3S)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 10 - (3, 5-ジメチル-1-(4カルボキシフェニル)ピラゾール-4-
 イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸
 塩



TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

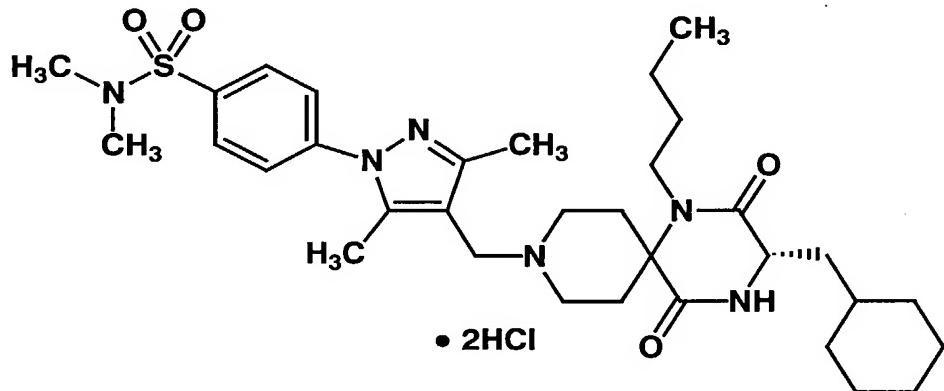
NMR (CD_3OD) : δ 8.19 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.93-3.80 (m, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.43-3.38 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.75-1.18 (m, 15H), 0.96 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5

実施例 4 0 (4 1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(3,5-ジメチル-1-(4-(ジメチルアミノスルホニル)フェニル)
ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウ

10 ンデカン・2塩酸塩



TLC : Rf 0.54 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.96 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.78 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.31 (s,

2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.48

15 (m, 2H), 2.74 (s, 6H), 2.59 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.29-2.10 (m,

2H), 1.84-1.16 (m, 13H), 1.06-0.86 (m, 5H)。

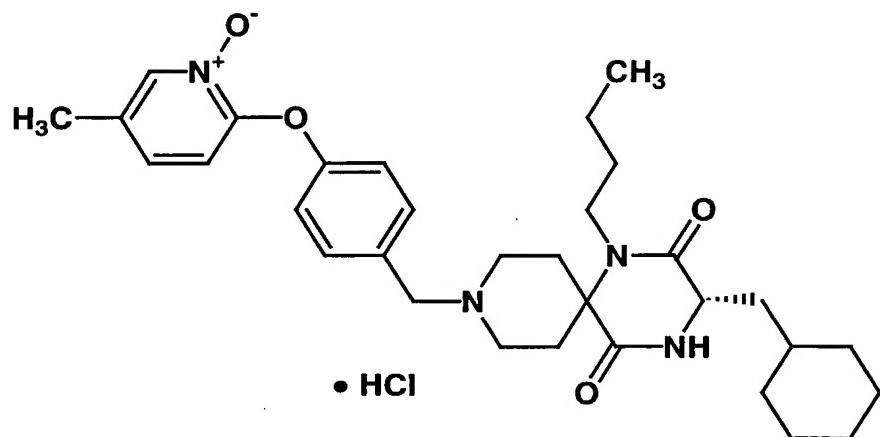
実施例 4 0 (4 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-

20 - (4-(5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ)フェニル

922

メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

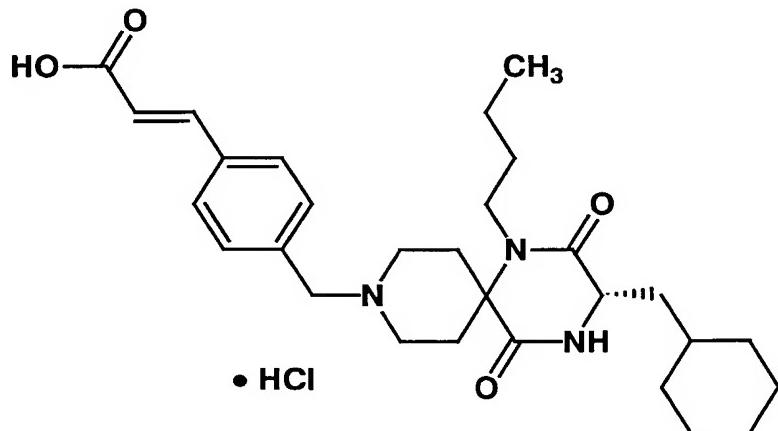


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.77 (brs, 1H), 7.61 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.56 (dd, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 6.73 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.52-3.35 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.84-1.14 (m, 15H), 1.04-0.96 (m, 5H)。

実施例 40 (43)

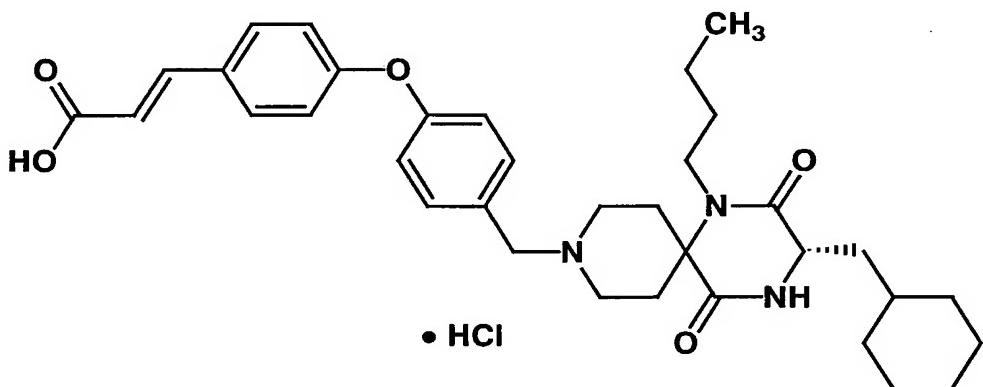
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリルメチル - 9 - (4 - (2 - カルボキシ - 1 - エチニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.17 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.57 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H),
 5 1.92-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 4 0 (4 4)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (4-(4-(1E)-2-カルボキシ-1-エチニル)フェニルオキ
 10 シ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・
 塩酸塩

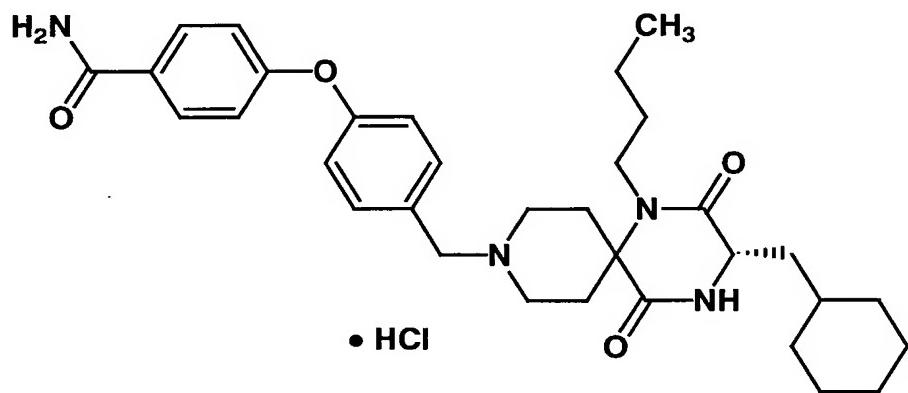


TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.69-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.42 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.55-3.36 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 4 0 (4 5)

20 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9

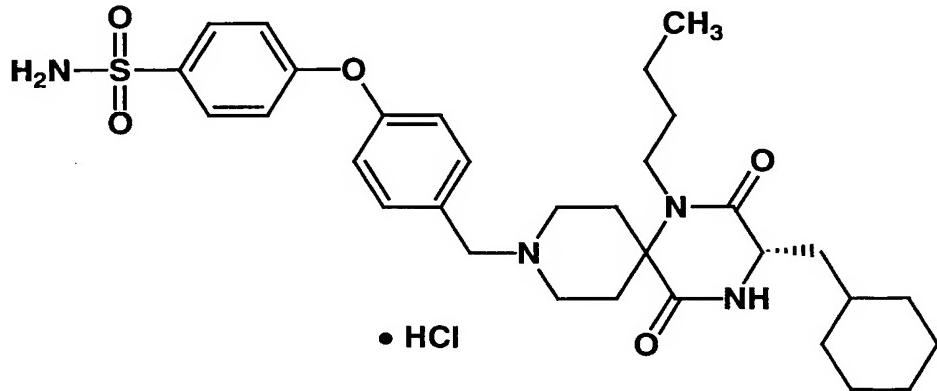
- (4-(4-アミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム:メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5, Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.84-1.13 (m, 15H), 1.06-0.86 (m, 5H)。

10 実施例40(46)

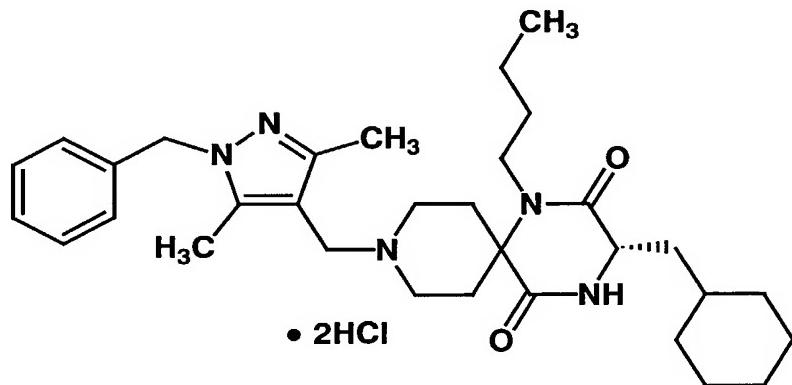
(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - (4 - (4 - アミノスルホニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (d_6 -DMSO) : δ 11.03 (brs, 1H), 8.42 (brs, 1H), 7.82 (d, J = 8.7 Hz, 2H),
 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.33 (brs, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 4H), 4.38-4.23 (m,
 2H), 3.91 (m, 1H), 3.61-3.23 (m, 6H), 2.58-2.30 (m, 2H), 2.18-1.91 (m, 2H),
 5 1.76-1.00 (m, 15H), 0.98-0.71 (m, 5H)。

実施例40(47)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (3,5-ジメチル-1-ベンジルピラゾール-4-イルメチル) -1,
 10 4,9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2塩酸塩

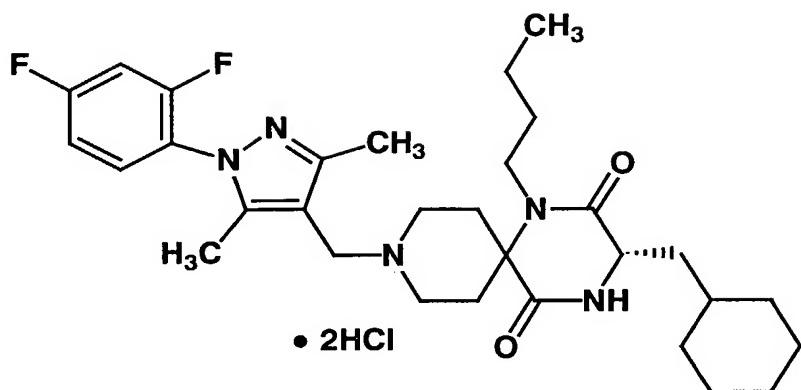


TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.41-7.33 (m, 3H), 7.22-7.20 (m, 2H), 5.46 (s, 2H), 4.31 (s,
 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.74 (m, 2H), 3.58-3.48 (m, 4H), 2.61
 15 (m, 2H), 2.47 (s, 6H), 2.24-2.09 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz,
 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例40(48)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (3,5-ジメチル-1-(2,4-ジフルオロフェニル)ピラゾール-
 20

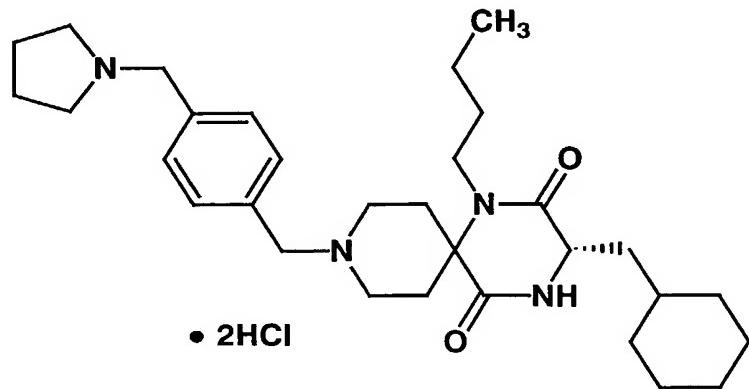
4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2
塩酸塩



TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 1 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.58-7.51 (m, 1H), 7.33-7.25 (m, 1H), 7.22-7.16 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.78 (m, 2H), 3.59 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 2.49 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.27-2.15 (m, 2H), 1.81-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

10 実施例40(49)

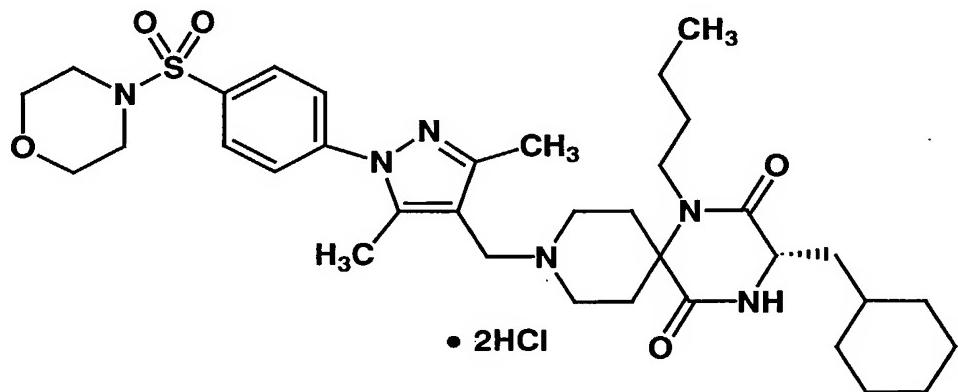
(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (4-(ピロリジン-1-イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.14 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.38 (m, 6H), 3.28-3.10 (m, 2H), 2.66-2.48 (m, 2H), 2.26-1.92 (m, 6H), 1.83-1.10 (m, 5H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (50)

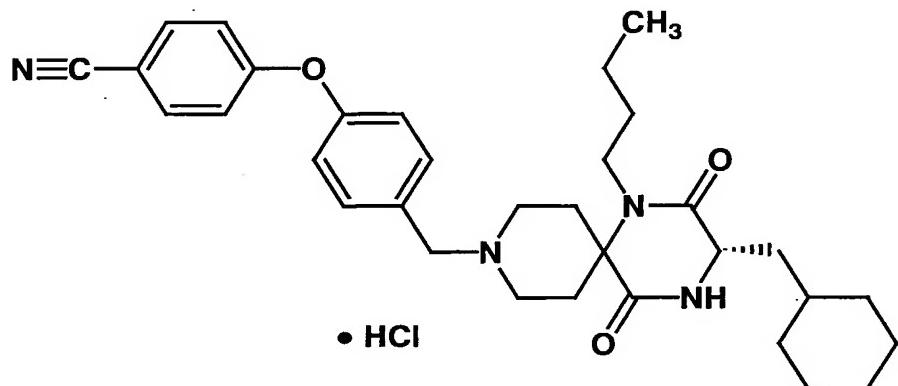
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (3,5-ジメチル-1-(4-(モルホン-4-イルスルホニル)フェ
 10 ニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ [5.
 5] ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.95 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.80 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.76-3.67 (m, 4H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.10-2.92 (m, 4H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.84-1.08 (m, 15H), 1.08-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (51)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9
 - (4 - (4 - シアノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト
 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

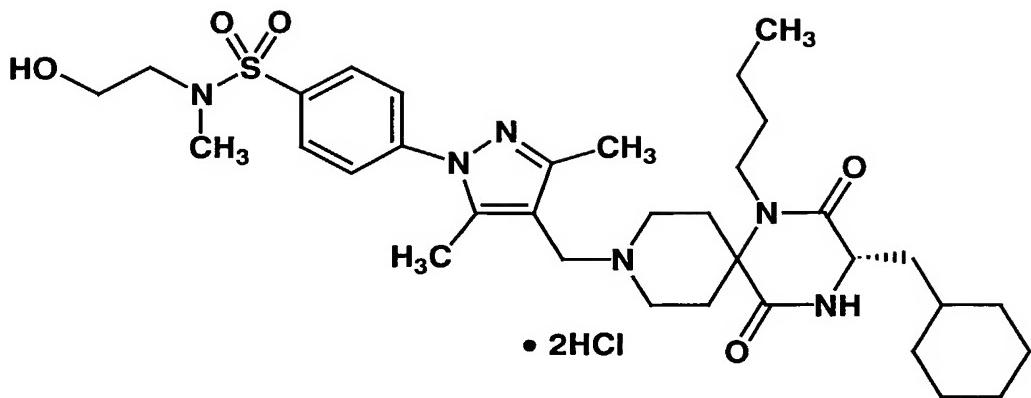


5 TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.32-2.08 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

10

実施例 40 (52)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9
 - (3, 5 - デミチル - 1 - (4 - (N - (2 - ヒドロキシエチル) - N -
 メチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1,
 15 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.33 (s,

2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.76 (m, 2H), 3.70 (t, J = 5.7 Hz, 2H),

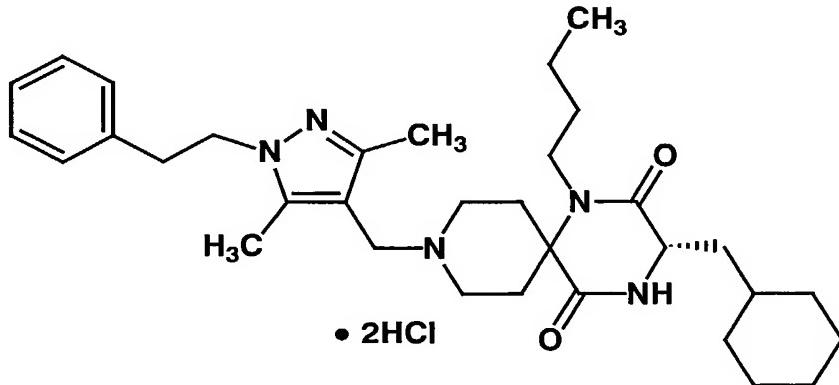
5 3.68-3.60 (m, 2H), 3.58-3.42 (m, 2H), 3.20 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.72-

2.58 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H),

0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (53)

10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4-イル
メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



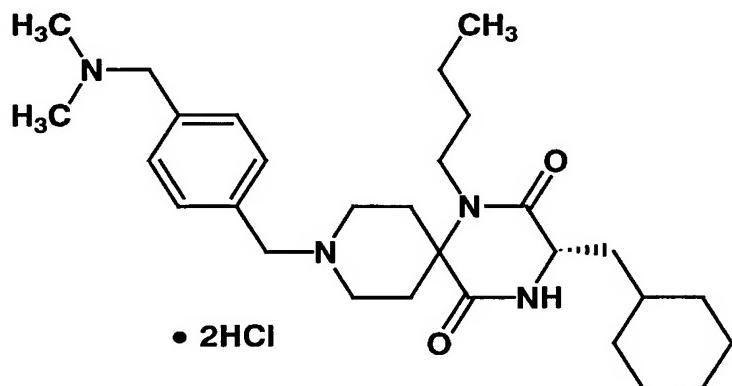
TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.28-7.23 (m, 3H), 7.10 - 7.07 (m, 2H), 4.40 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.19 (s, 2H), 4.06 (dd, $J = 7.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.80-3.60 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 3.12 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.64-2.45 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.26-2.04 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.84-1.14 (m, 15H), 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

5

実施例 4 0 (5 4)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(ジメチルアミノメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

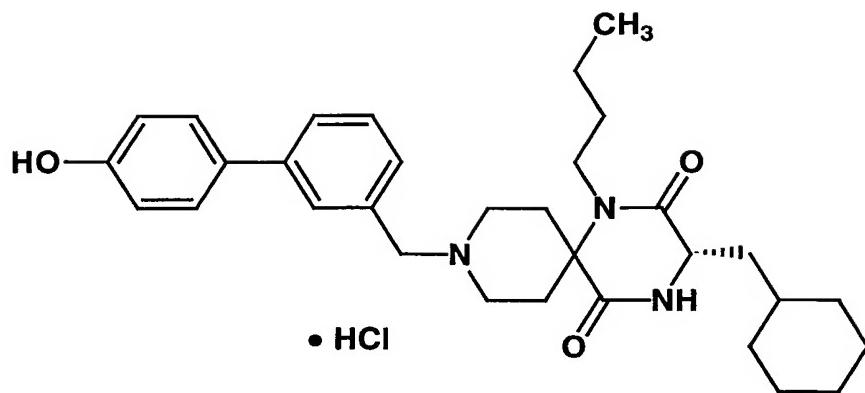
TLC : Rf 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.76 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.63 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 5.1$ Hz, 1H), 3.90-3.75 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.87 (s, 6H), 2.64-2.48 (m, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 1.80-1.15 (m, 15H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

実施例 4 0 (5 5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-(4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリア

20 アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

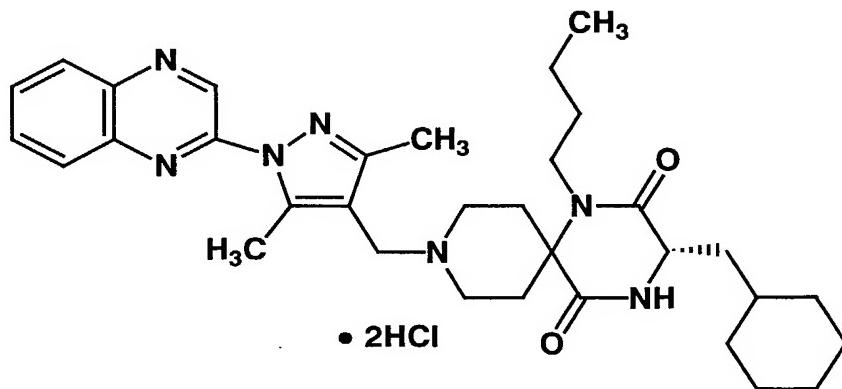


TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.69 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.73 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 3.43-3.32 (m, 2H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.08-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例40(56)

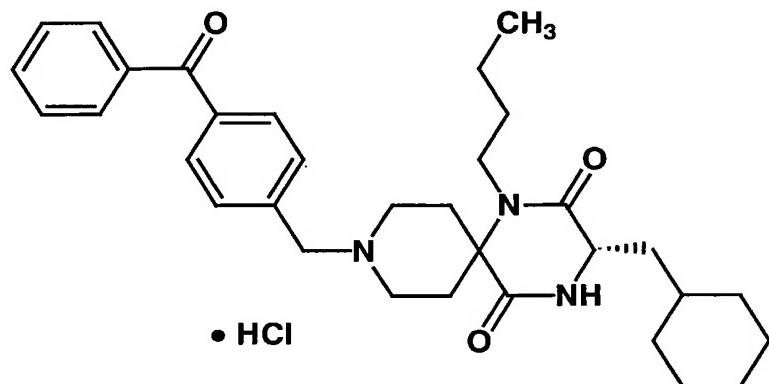
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール-4-
-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸
塩



TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.51 (s, 1H), 8.13 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.0 Hz, 1H),
 7.91-7.80 (m, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.82 (m, 2H),
 3.63 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 2.29-2.16
 5 (m, 2H), 1.80-1.18 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 40 (57)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (4-(フェニルカルボニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザ
 10 スピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

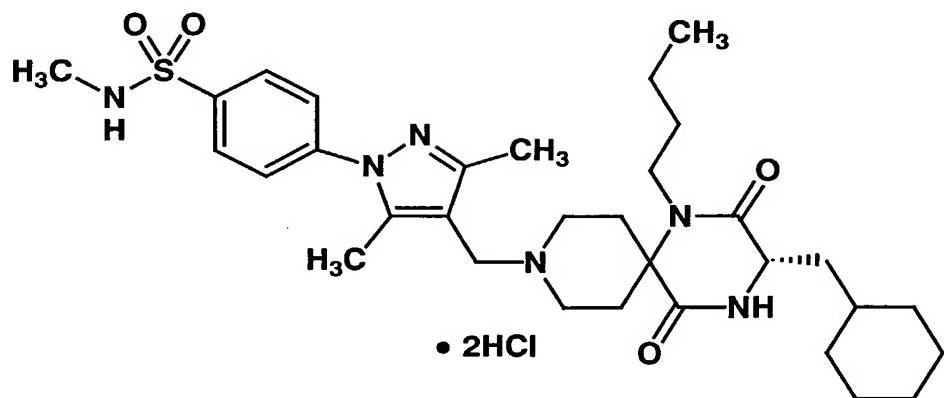


TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.82-7.74 (m, 4H), 7.67 (t, J = 8.4
 Hz, 1H), 7.57-7.51 (m, 2H), 4.48 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.78
 15 (m, 2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.82-1.14 (m,
 15H), 1.02-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (58)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (3,5-ジメチル-1-(4-メチルアミノスルホニルフェニル)ピラ
 20

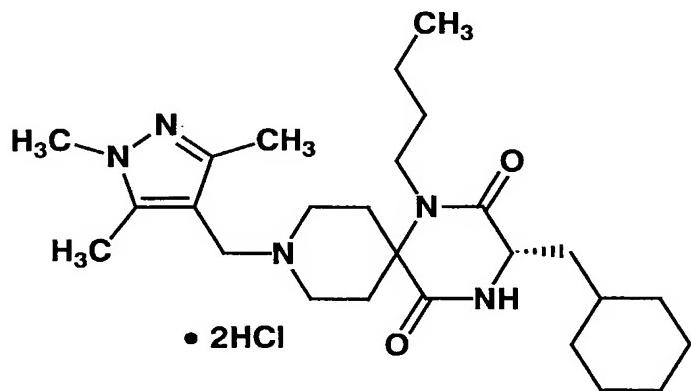
ゾールー 4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
カン・2 塩酸塩



- TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.59-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.34-2.10 (m, 2H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.97 (m, 2H).

10 実施例 40 (59)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 -(1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

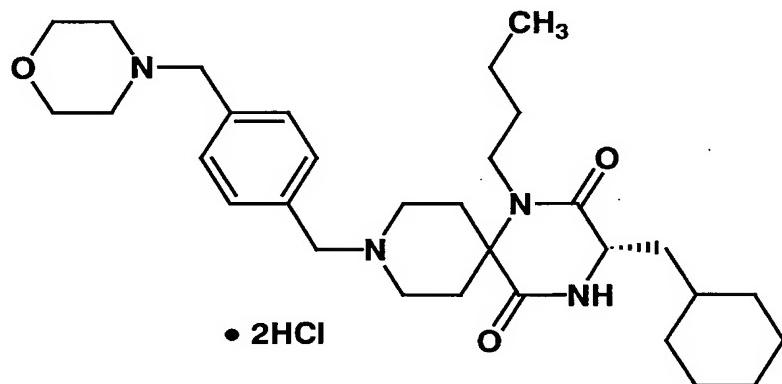


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H),
 3.87-3.69 (m, 2H), 3.61-3.43 (m, 4H), 2.69-2.50 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s,
 3H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

5

実施例 40 (60)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 -(4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニルメチル)-1,4,9-
 トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



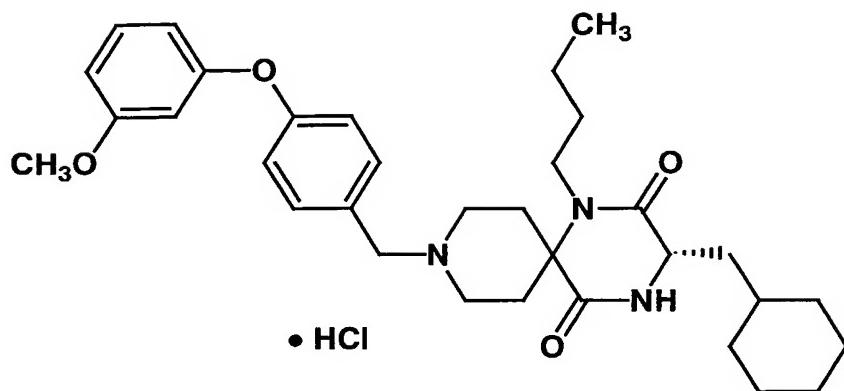
10

TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s,
 4H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.00-3.70 (m, 6H), 3.54-3.40 (m, 4H), 3.35-
 3.18 (m, 4H), 2.63-2.47 (m, 2H), 2.24-2.02 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.06-
 15 0.85 (m, 5H)。

実施例 40 (61)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 -(4-(3-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-
 トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

20

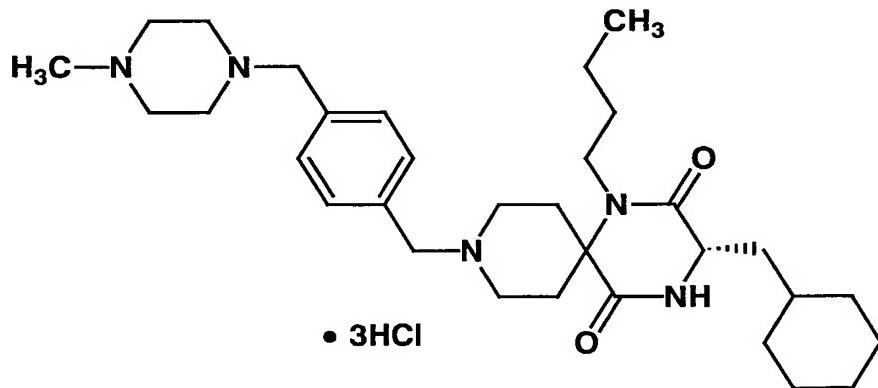


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.28 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.75 (ddd, J = 8.4, 2.4, 1.0 Hz, 1H), 6.61-6.57 (m, 2H), 4.34 (s, 2H), 5 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.55 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.53-3.47 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.50-2.35 (m, 2H), 2.25-2.11 (m, 2H), 1.80-1.23 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 40 (62)

- 10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
- (4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) フェニルメチル) -1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・3 塩酸塩

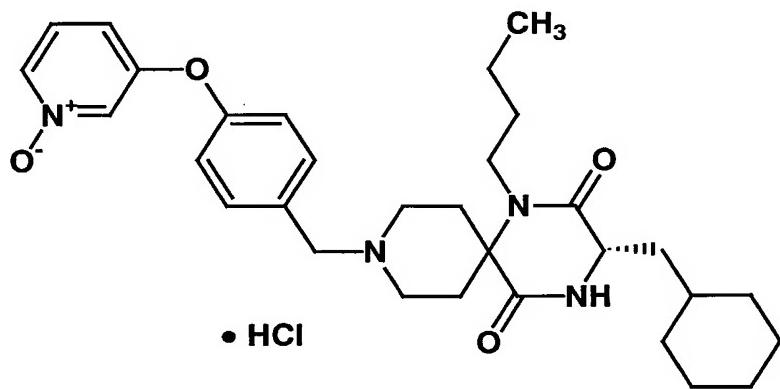


TLC : R_f 0.69 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (s, 4H), 4.54 (s, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.42 (m, 14H), 3.00 (s, 3H), 2.61-2.46 (m, 2H), 2.21-2.07 (m, 2H), 1.79-1.15 (m, 15H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5 実施例 4 0 (6 3)

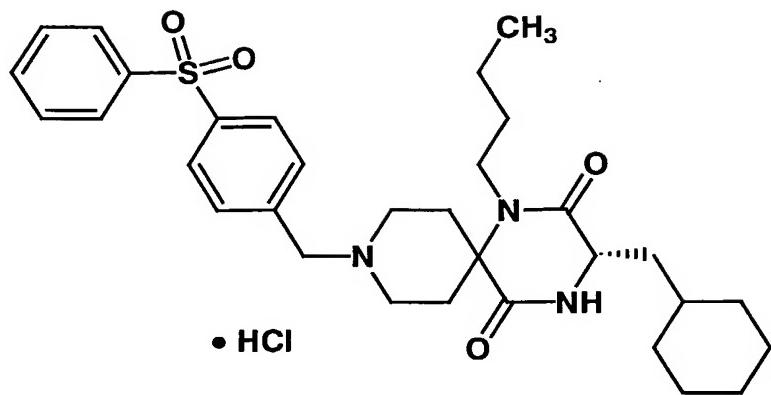
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (4-(ピリジン-1-オキシド-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.45 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 8.37 (brd, J = 6.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 8.4, 6.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (brdd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 15 1.04-0.90 (m, 5H)。

実施例 4 0 (6 4)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (4-フェニルスルホニルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

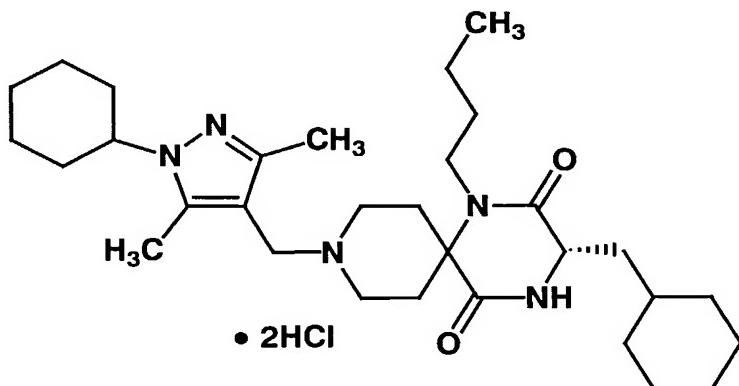


TLC : R_f 0.77 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.08 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.02-7.96 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70-7.55 (m, 3H), 4.43 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.89-3.73 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.48-2.33 (m, 2H), 2.23-2.04 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.03-0.85 (m, 5H).

実施例 40 (65)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-
10 - (3, 5-ジメチル-1-シクロヘキシリルピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



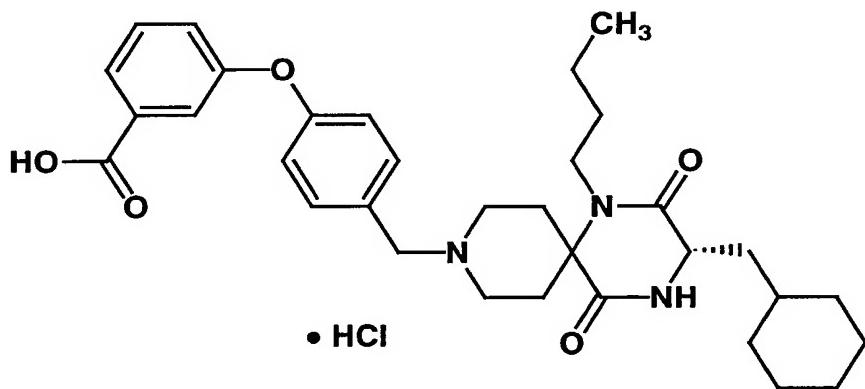
TLC : R_f 0.32 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.42-4.28 (m, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz,

1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.60-3.43 (m, 4H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.04-1.15 (m, 25H), 1.05-0.89 (m, 5H)。

実施例 4 0 (6 6)

5 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(3-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-
トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



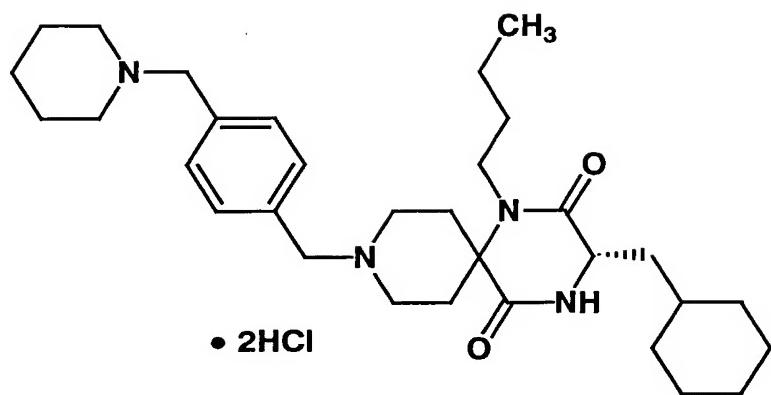
TLC : Rf 0.16 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

10 NMR (CD_3OD) : δ 7.83 (ddd, $J = 7.8, 1.5, 1.2$ Hz, 1H), 7.60 (dd, $J = 2.4, 1.5$ Hz, 1H), 7.57 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.51 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.29 (ddd, $J = 7.8, 2.4, 1.2$ Hz, 1H), 7.12 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.58-3.35 (m, 4H), 2.49-2.34 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.07-0.85 (m, 5H)。

15

実施例 4 0 (6 7)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-
トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

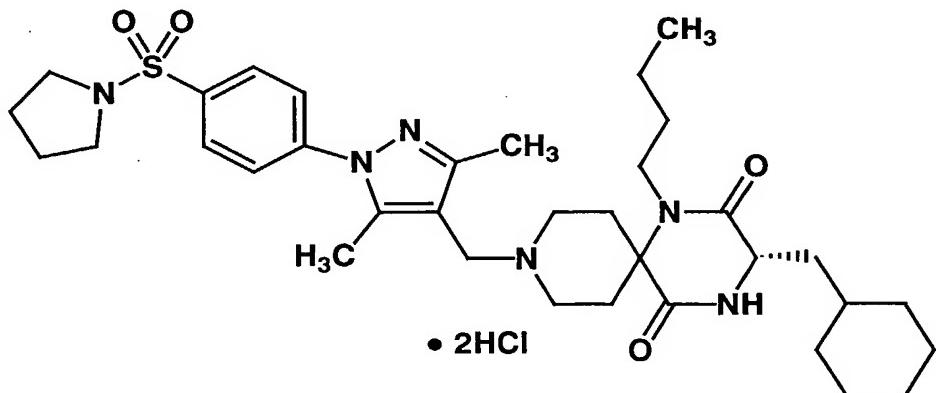


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.53-3.38 (m, 6H), 3.05-2.91 (m, 2H), 2.66-2.49 (m, 2H), 2.24-2.04 (m, 2H), 2.00-1.13 (m, 21H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (68)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
10 - (3, 5-ジメチル-1 - (4 - (ピロリジン-1-イルスルホニル) フ
エニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン・2塩酸塩



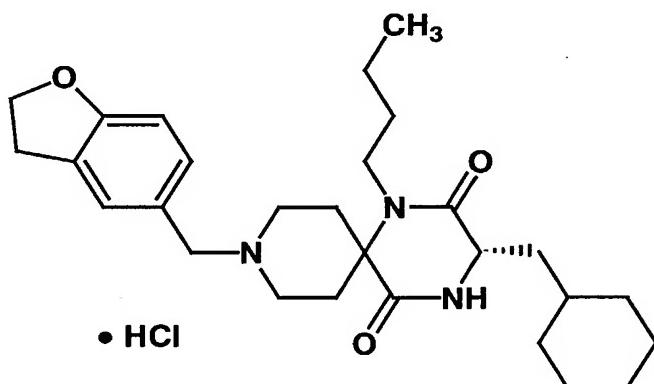
TLC : R_f 0.40 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.75 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.49-3.41 (m, 2H), 3.32-3.25 (m, 4H), 2.60-2.46 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30-2.11 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 19H), 1.05-0.87 (m, 5H)。

5

実施例 40 (69)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.61 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

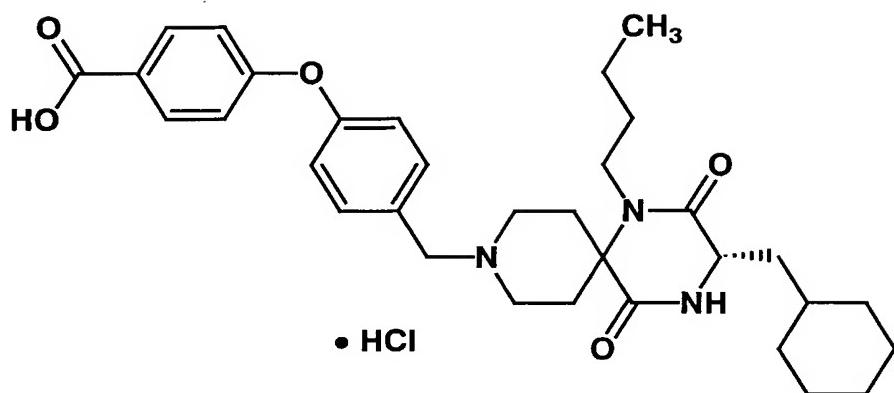
NMR (CD₃OD) : δ 7.39 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.59 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.54-3.34 (m, 4H), 3.25 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 2.48-2.31 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 15H), 1.04-0.87 (m, 5H)。

実施例 40 (70)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-

- (4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-

20 -トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

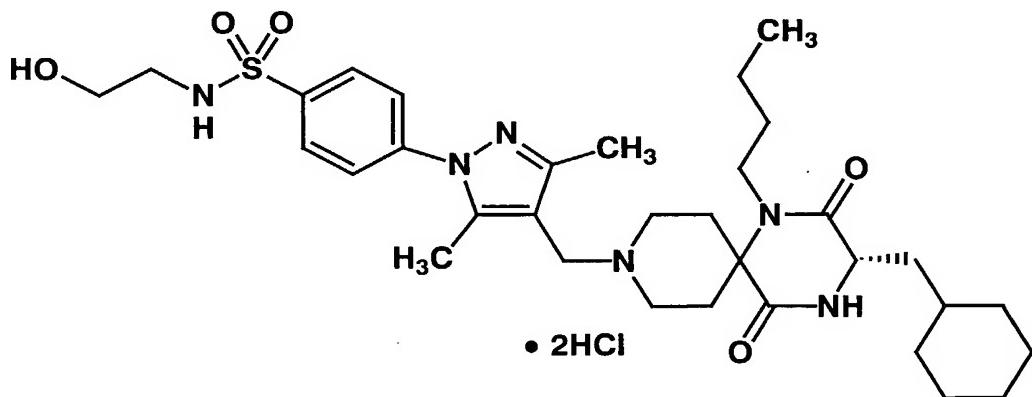


TLC : R_f 0.55 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),
5 3.91-3.74 (m, 2H), 3.57-3.35 (m, 4H), 2.50-2.33 (m, 2H), 2.29-2.09 (m, 2H),
1.84-1.14 (m, 15H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (71)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
10 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(2-ヒドロキシエチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

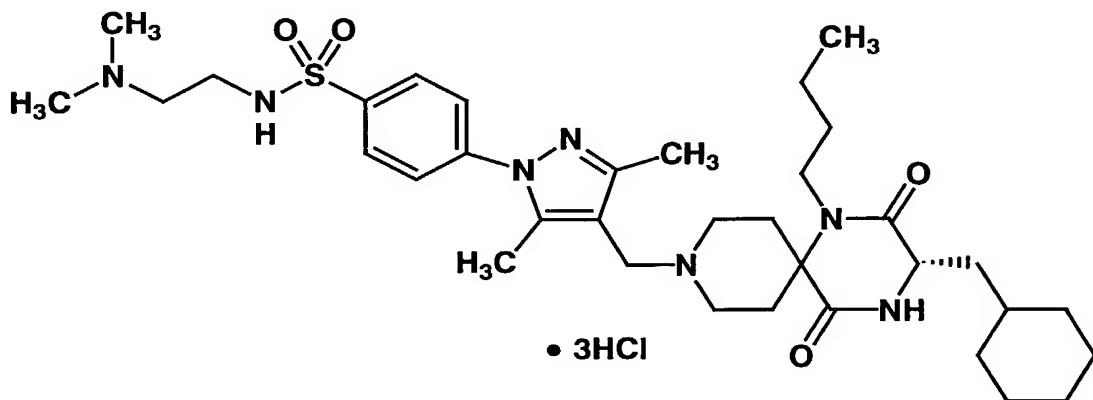


TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.03 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.72 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.56 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.51-3.41 (m, 2H), 3.01 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 2.63-2.43 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.32-2.10 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.06-0.93 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 4 0 (7 2)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(2-ジメチルアミノエチルアミノスル
 10 ホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル-1, 4, 9-トリアザ
 スピロ [5. 5] ウンデカン・3 塩酸塩

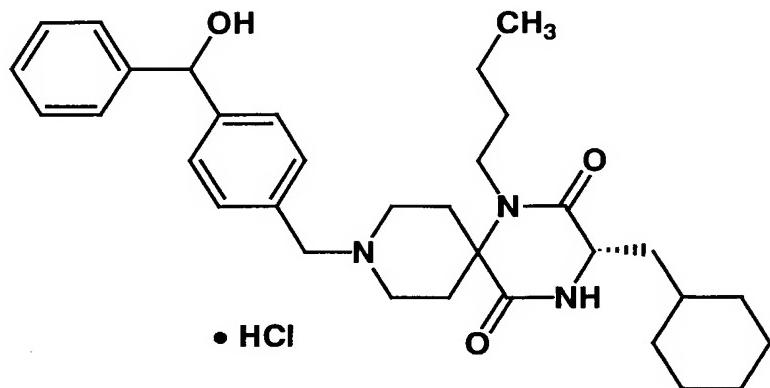


TLC : Rf 0.13 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 8.07 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.79 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.2$ Hz, 1H), 3.82-3.76 (m, 2H), 3.68-3.48 (m, 4H), 3.34-3.24 (m, 4H), 2.95 (s, 6H), 2.76-2.52 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 4 0 (7 3)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-

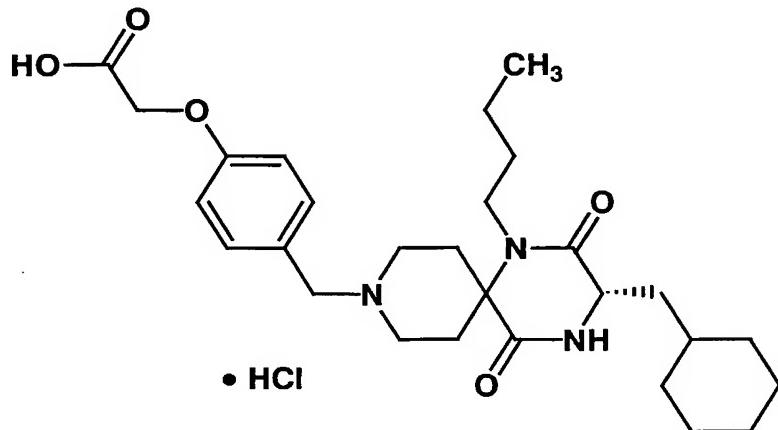
– (4 – (1 – ヒドロキシ – 1 – フェニルメチル) フェニルメチル) – 1 ,
4 , 9 – トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
5 NMR (CD_3OD) : δ 7.62-7.18 (m, 9H), 5.82 (s, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.58-3.30 (m, 4H), 2.42-2.04 (m, 4H), 1.82-1.24 (m, 15H), 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.94 (m, 2H)。

実施例 40 (74)

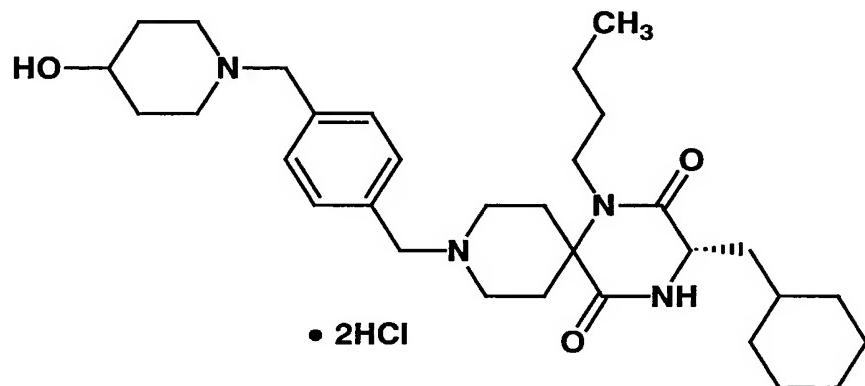
10 (3S) – 1 – ブチル – 2 , 5 – ジオキソ – 3 – シクロヘキシリメチル – 9
– (4 – (カルボキシメチルオキシ) フェニルメチル) – 1 , 4 , 9 – トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.70 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.54-3.33 (m, 4H), 2.44-2.28 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

実施例 40 (75)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 - (4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) フェニルメチル)
 10 - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

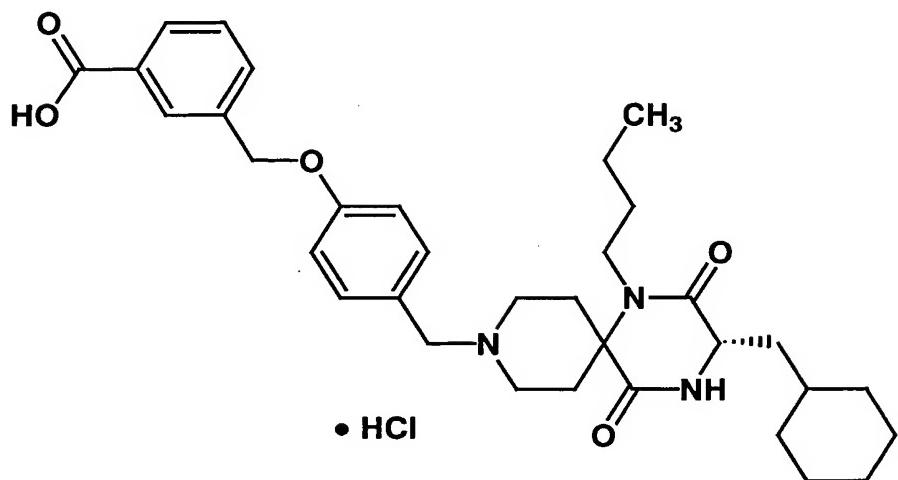


TLC : R_f 0.17 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.76 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.70-7.61 (m, 2H), 4.40 (s, 2H),
 4.38-4.32 (m, 2H), 4.10-4.05 (m, 1H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.68 (m,
 15 2H), 3.56-3.40 (m, 4H), 3.18-3.00 (m, 1H), 2.70-2.48 (m, 2H), 2.23-1.82 (m, 5H),
 1.82-1.10 (m, 19H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (76)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 20 - (4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ) フェニルメチル) - 1,

4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

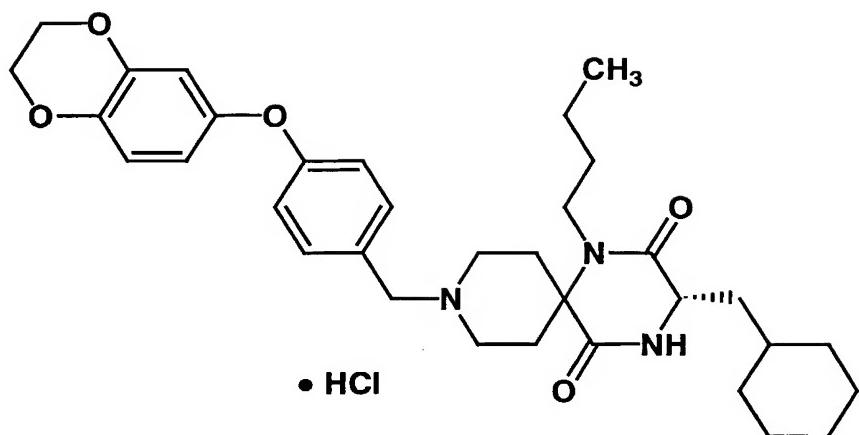


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.10 (s, 1H), 7.98 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.32 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

10 実施例 40 (77)

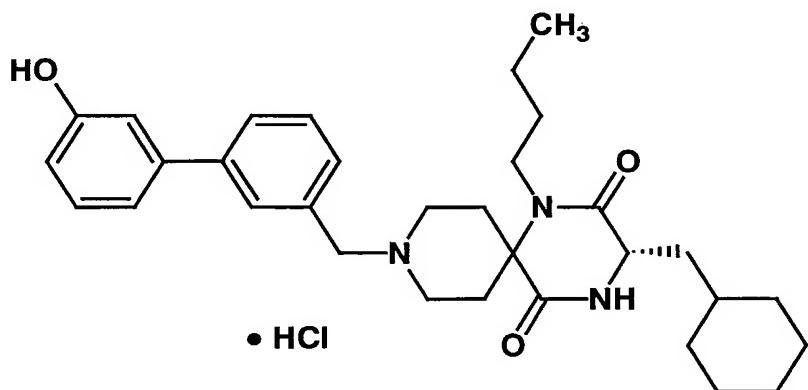
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (4-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルオキシ) フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.86 (m, 1H), 6.55 - 6.51 (m, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.24 (s, 4H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.86-3.70 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.12 (m, 15H),
 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (78)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 10 - (3-(3-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
 アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



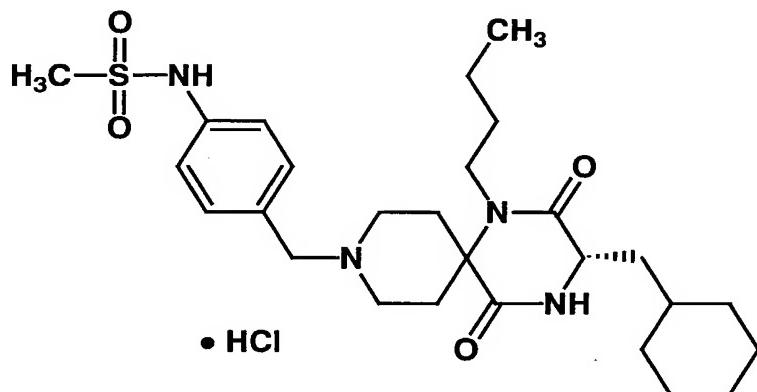
TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.60-7.50 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.15-7.08 (m, 2H), 6.82 (m, 1H), 4.43 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.58-3.34 (m, 4H), 2.48-2.08 (m, 4H), 1.84-1.12 (m, 15H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 4 0 (7 9)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(メチルスルホニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

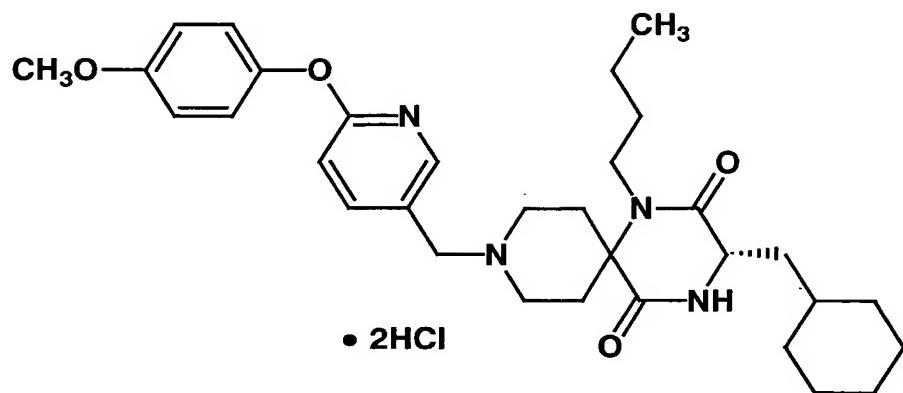
NMR (CD_3OD) : δ 7.53 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.34 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.86 (m, 15H), 0.95 (s, 5H)。

15

実施例 4 0 (8 0)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(6-(4-メトキシフェニル)ピリジン-3-イルメチル)-1,4,
9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

20



TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.26 (m, 1H), 8.02 (m, 1H), 7.08-6.84 (m, 5H), 4.38 (s, 2H),

4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.56-3.44 (m, 2H),

5 3.42-3.32 (m, 2H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H),

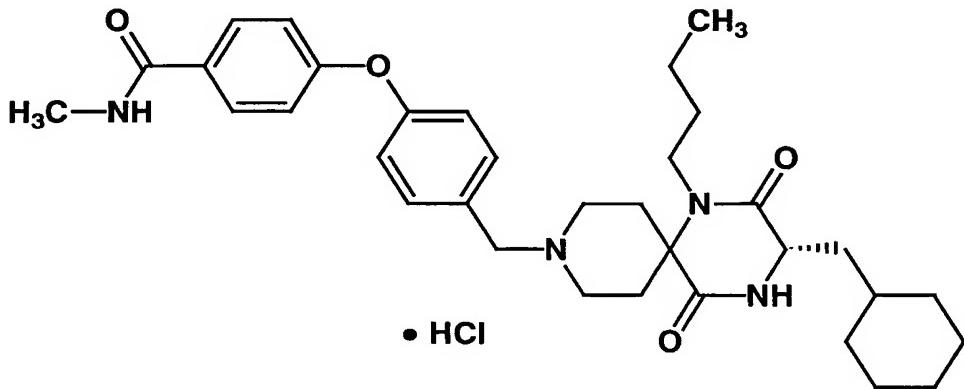
1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (81)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9

10 - (4-(4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル)

-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

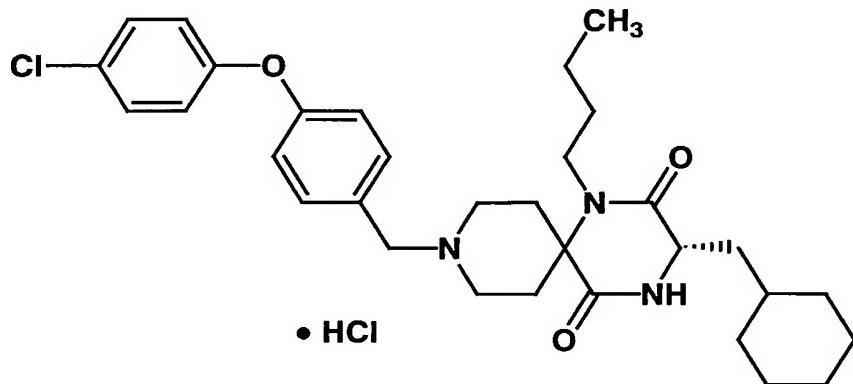
NMR (CD₃OD) : δ 8.39 (br d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.58 (d,

$J = 8.4$ Hz, 2H), 7.15 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.07 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.85-3.74 (m, 2H), 3.53-3.38 (m, 4H), 2.91 (d, $J = 4.5$ Hz, 3H), 2.55-2.30 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5

実施例 4 0 (8 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(4-クロロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-ト
リアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



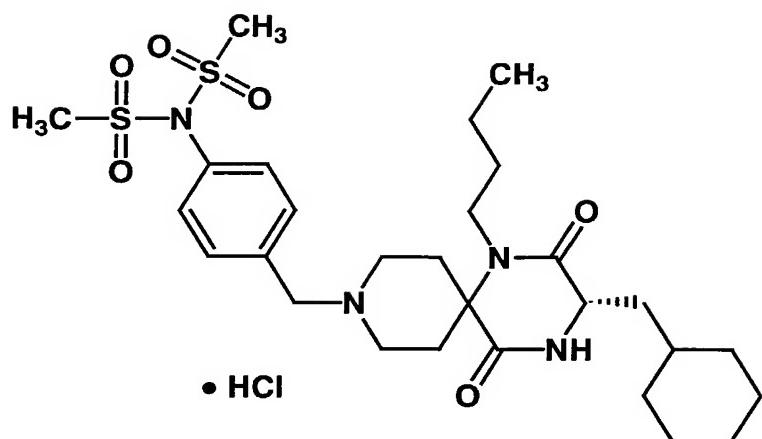
10

TLC : Rf 0.76 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 7.52 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.38 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.09 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.02 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.60-3.30 (m, 4H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.90-1.10 (m, 15H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

実施例 4 0 (8 3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-ビス(メチルスルホニル)アミノフェニルメチル)-1,4,9-ト
リアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

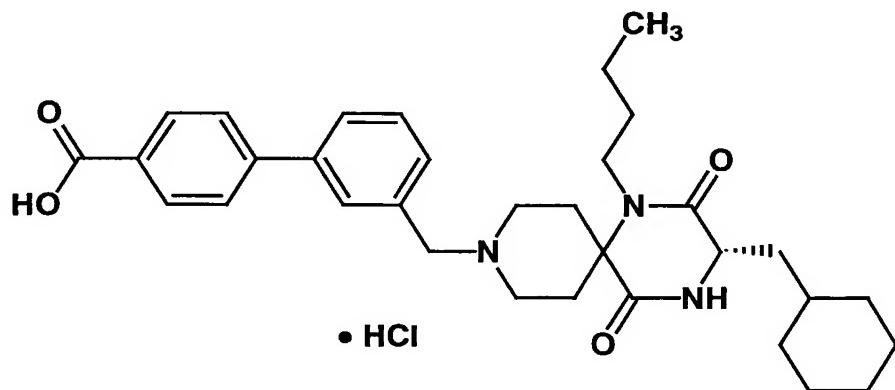
15



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 3.47 (s, 6H), 2.46-2.08 (m, 4H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (84)

(3S)-1-(ブチル)-2-, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 10 - (3 - (4 -カルボキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -トリ
 アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



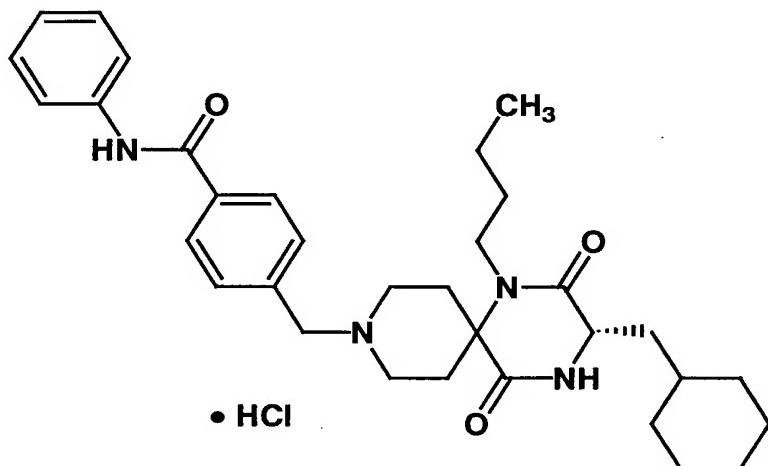
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.13 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.95 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.82 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.66-7.61 (m, 2H), 4.46 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.62-3.36 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.08 (m, 15H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 4 0 (8 5)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(フェニルアミノカルボニル)フェニルメチル)-1,4,9-ト
リアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

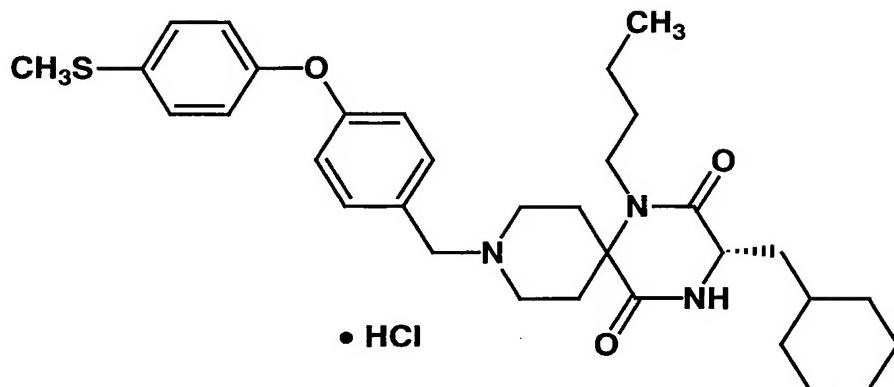
NMR (CD_3OD) : δ 8.07 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.73-7.67 (m, 2H), 7.71 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.38 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.17 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 4.45 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.92-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.08 (m, 4H),

15 1.84-1.08 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.8$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 4 0 (8 6)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
-(4-(4-メチルチオフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9

-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

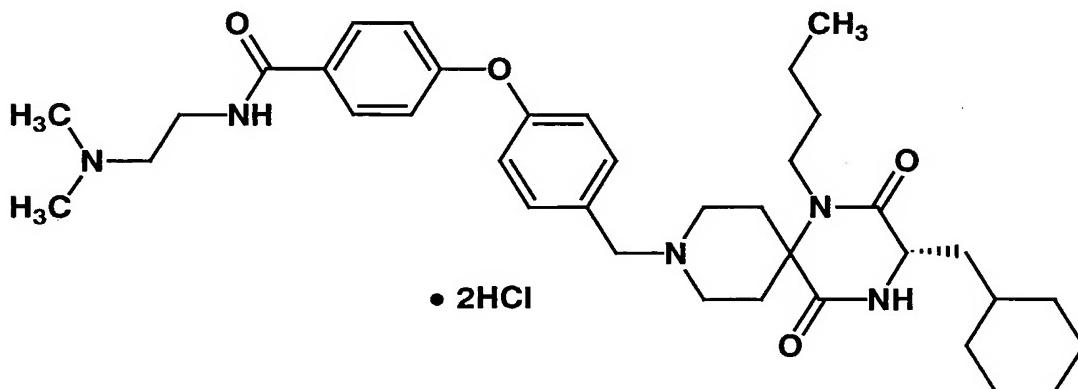


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (87)

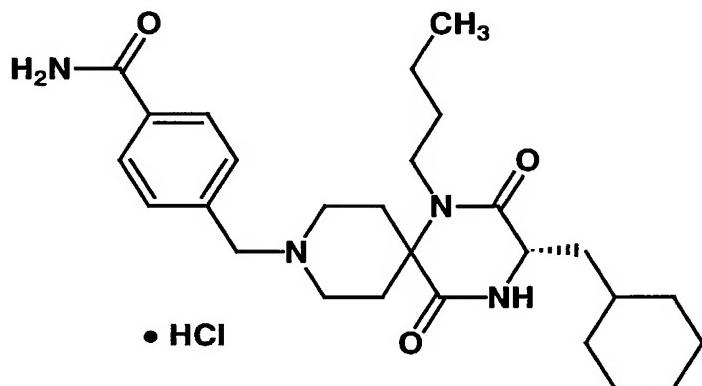
10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-((4-(4-(2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル)フェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.11 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 4H), 3.52-3.36 (m, 6H), 2.98 (s, 6H), 2.62-2.44 (m, 2H), 2.24-2.08
 5 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.00-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (88)

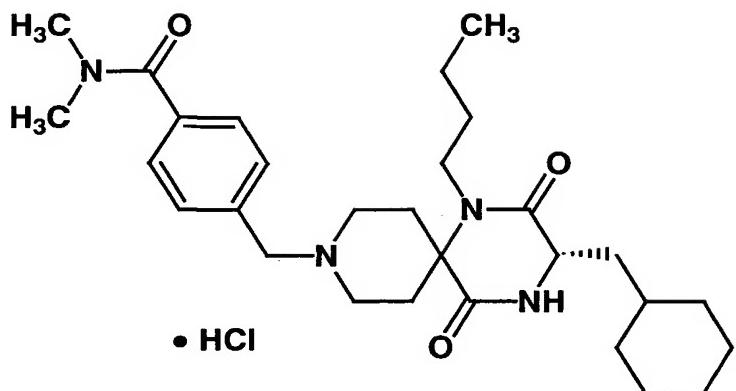
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (4-アミノカルボニルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ
 10 [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.19 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.54-3.28 (m, 4H), 2.52-
 15 2.36 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (89)

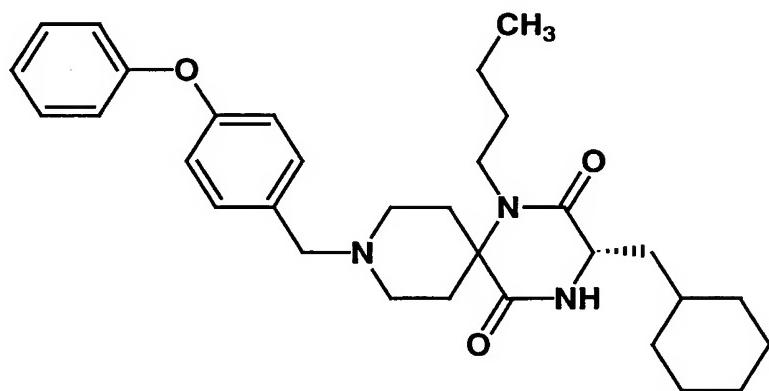
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-
 - (4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニルメチル)-1,4,9-ト
 20 リアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : Rf 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.67 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.54 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 4.2$ Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 3.11 (s, 5H), 2.99 (s, 3H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.86 (m, 5H).

実施例 40 (90)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9
 10 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン



TLC : Rf 0.73 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CDCl_3) : δ 7.37-7.25 (m, 4H), 7.10 (m, 1H), 7.04-6.98 (m, 2H), 6.96 (d, 15H), $J = 8.7$ Hz, 2H), 5.81 (brs, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.52-3.32 (m, 2H),

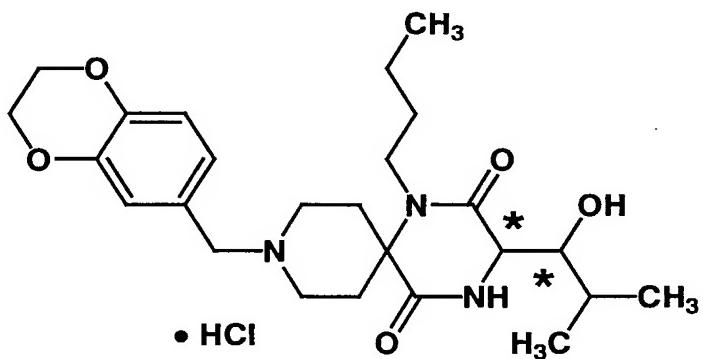
2.92-2.74 (m, 3H), 2.57 (dt, J = 12.0, 3.0 Hz, 1H), 2.18-1.88 (m, 5H), 1.76-1.13 (m, 14H), 1.07-0.88 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 4 1

5 参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン、n-ブチルアミンおよび (2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸を用いて、参考例 3→参考例 4 と同様の操作をし、さらに 1, 4-ベンゾジオキサン-6-カルボキシアルデヒドを用いて、参考例 5→参考例 6→実施例 1
10 と同様の操作をし、以下の本発明化合物 (1) および (2) をそれぞれ得た。

実施例 4 1 (1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-
15 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



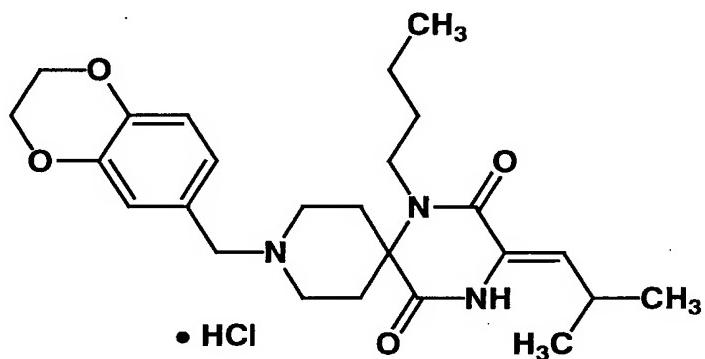
(*は、syn 体と anti 体が 2 : 3 の割合で混合していることを表す。)

TLC : Rf 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 0.6H), 4.08 (d, J = 1.2 Hz, 0.4H), 4.05-3.90 (m, 1H), 3.76-3.63 (m, 1H), 3.62-3.35 (m, 3.4H),
20

3.19 (dd, $J = 9.6, 2.1$ Hz, 0.6H), 3.20-3.10 (m, 1H), 2.55-2.33 (m, 2H), 2.30-1.95 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 1H), 1.55-1.25 (m, 3H), 1.05-0.89 (m, 9H)。

実施例 4 1 (2)

5 (Z) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピリデン) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

10 NMR (CD_3OD) : δ 7.04 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 5.84 (d, $J = 10.5$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.72-3.55 (m, 2H), 3.53-3.35 (m, 4H), 2.80-2.60 (m, 1H), 2.43-2.26 (m, 2H), 2.25-2.15 (m, 2H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.45-1.30 (m, 2H), 1.04 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

15

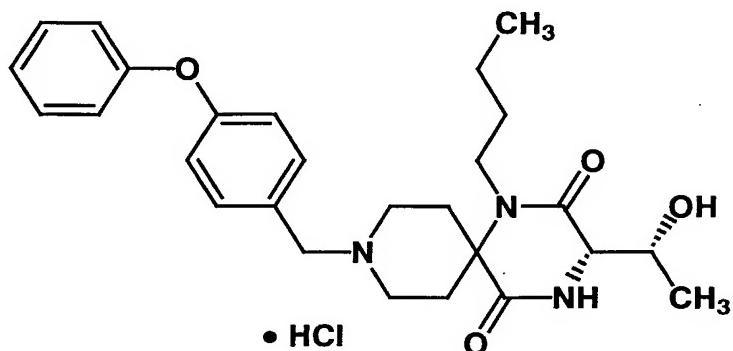
実施例 4 1 (3) ~ 4 1 (5)

(2R*, 3R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸の代わりに相当する化合物を、 1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - カルボキシアルデヒドの代わりに相当する化合物を用いて、 実施例 4 1 と同様の操作をし、 以下の本発明化合物を得た。

実施例 4 1 (3)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシエチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

5

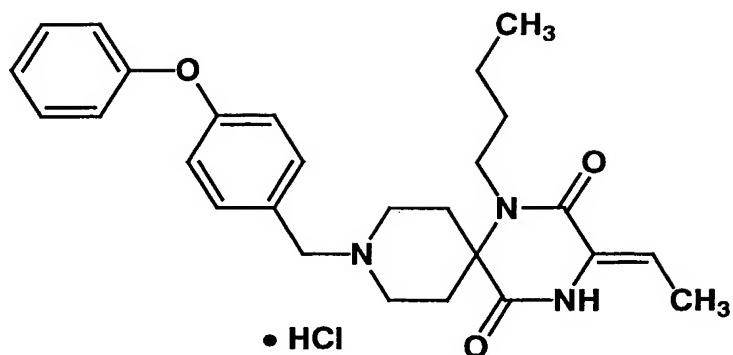


TLC : Rf 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.54 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.08-7.00 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.19 (dq, $J = 1.5, 6.9$ Hz, 1H), 4.10-3.97 (m, 1H), 3.78 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 3.72-3.51 (m, 2H), 3.51-3.40 (m, 2H), 3.28-3.14 (m, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.40-2.25 (m, 1H), 2.21-2.10 (m, 1H), 1.81-1.60 (m, 1H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.22 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 4 1 (4)

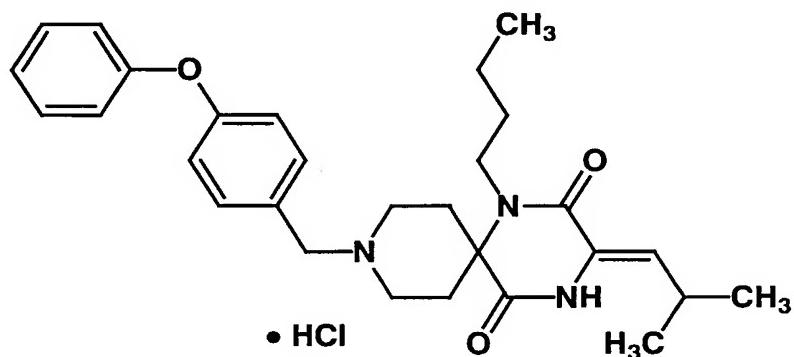
(Z) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - エチリデン - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 6.08 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 3.76-3.61 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.45-2.30 (m, 2H), 2.28-2.15 (m, 2H), 1.77 (d, J = 7.5 Hz, 3H), 1.62-1.46 (m, 2H), 1.44-1.28 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。
 5

実施例 4 1 (5)

(Z)-1-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-5-[(4-フェニルオキシ)カルバモイル]-(2-メチルプロピリデン)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩
 10

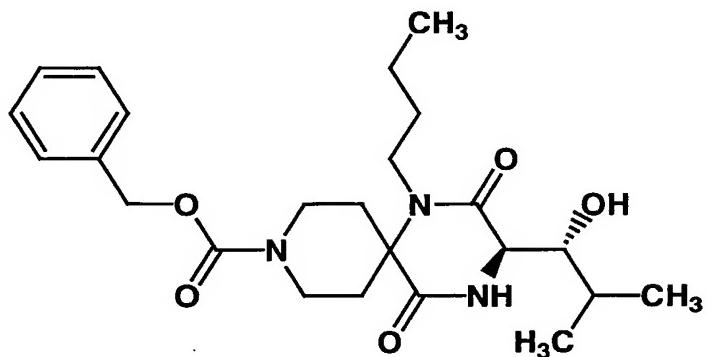


TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.08-7.01 (m, 2H), 5.85 (d, J = 10.5 Hz, 1H),
 15

4.34 (s, 2H), 3.78-3.64 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.78-2.62 (m, 1H), 2.43-2.18 (m, 4H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.46-1.30 (m, 2H), 1.04 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

5 実施例4 2

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



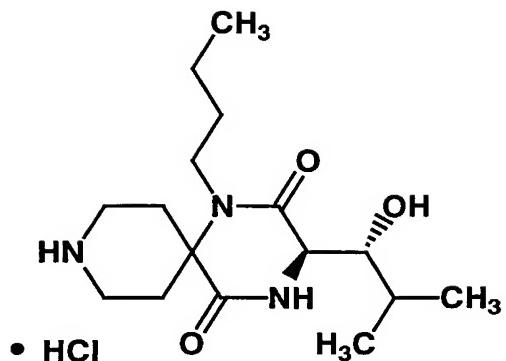
10 N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - ロイシンの代わりに、(2 R*, 3 R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例3 5と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.30 (m, 5H), 5.13 (br, 2H), 4.12 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.10-4.00 (m, 2H), 3.76-3.50 (m, 2H), 3.39-3.25 (m, 2H), 3.10-2.94 (m, 1H), 2.18 (m, 1H), 2.08-1.83 (m, 4H), 1.70-1.56 (m, 1H), 1.45-1.15 (m, 3H), 1.01-0.89 (m, 9H)。

20 実施例4 3

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロ

キシ-2-メチルプロピル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



実施例4 2で製造した化合物を用いて、実施例9と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.08 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.71 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H), 1.07-0.94 (m, 9H)。

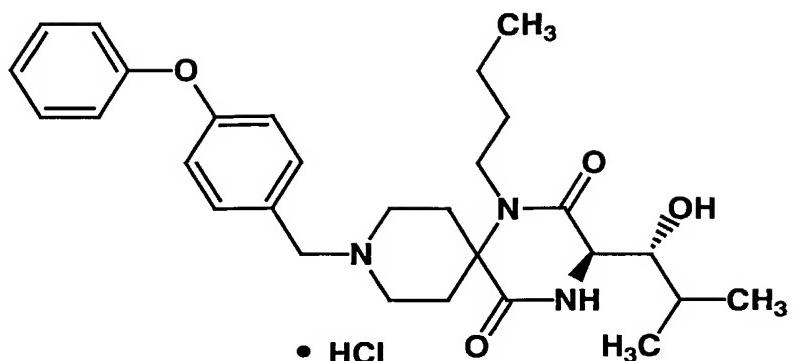
実施例4 4 (1) ~ 4 4 (13)

実施例4 3で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例10と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

15

実施例4 4 (1)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

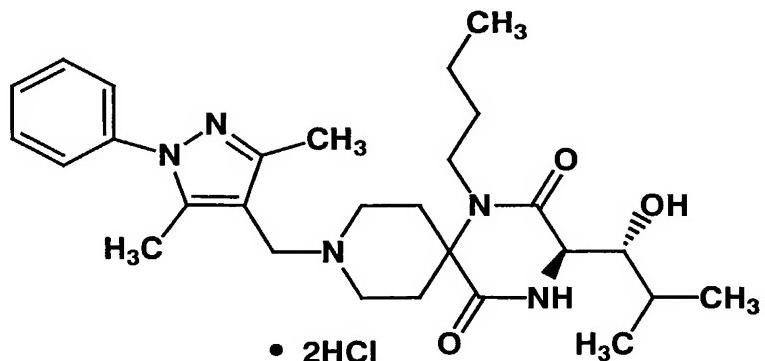


TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.93 (m, 1H), 3.80-3.67 (m, 1H), 3.56-3.40 (m, 3H), 3.19 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 3.20-3.10 (m, 1H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.35-2.20 (m, 1H), 2.19-2.08 (m, 1H), 2.07-1.91 (m, 1H), 1.80-1.70 (m, 1H), 1.50-1.25 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例4 4 (2)

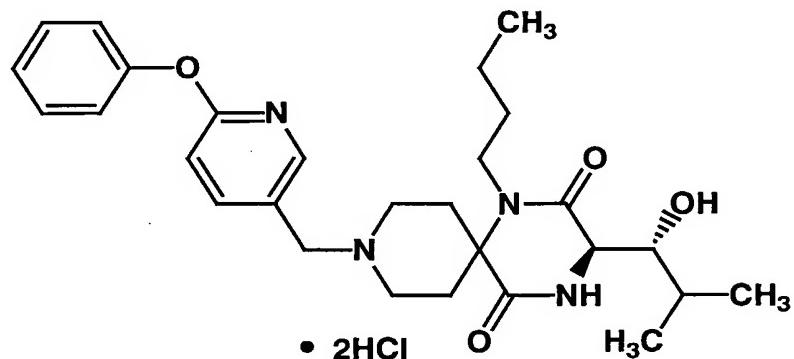
(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.45 (m, 5H), 4.30 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.4 Hz, 1H),
 4.05 (m, 1H), 3.79 (m, 1H), 3.62-3.48 (m, 3H), 3.29-3.16 (m, 2H), 2.60-2.45 (m,
 2H), 2.44-2.30 (m, 7H), 2.17 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.51-1.31 (m,
 5 3H), 1.03-0.91 (m, 9H)。

実施例4 4 (3)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロ
 キシ-2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イ
 10 ルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

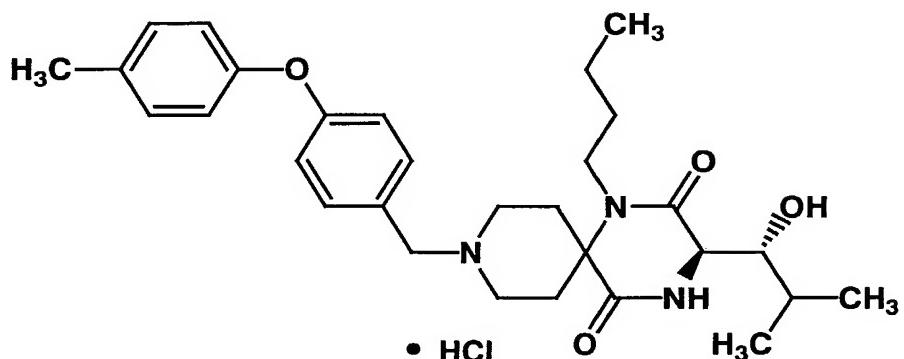


TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.16 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.46
 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.29 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.08 (d, J =
 15 8.4 Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.07-3.94 (m, 1H), 3.83-3.69
 (m, 1H), 3.60-3.42 (m, 3H), 3.29-3.22 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H),
 2.62-2.32 (m, 3H), 2.18-2.07 (m, 1H), 2.06-1.94 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50
 -1.31 (m, 3H), 1.07-0.87 (m, 9H)。

20 実施例4 4 (4)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

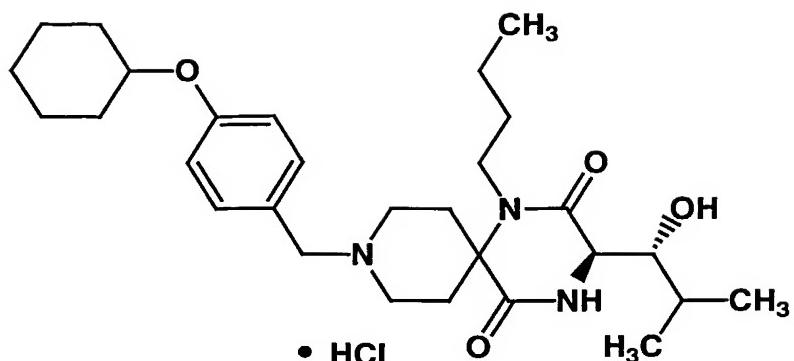
5



TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.97 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.56-3.39 (m, 2H), 3.25-3.09 (m, 3H), 2.53-2.08 (m, 7H),
 10 2.01 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.48-1.28 (m, 3H), 1.05-0.88 (m, 9H)。

実施例4 4 (5)

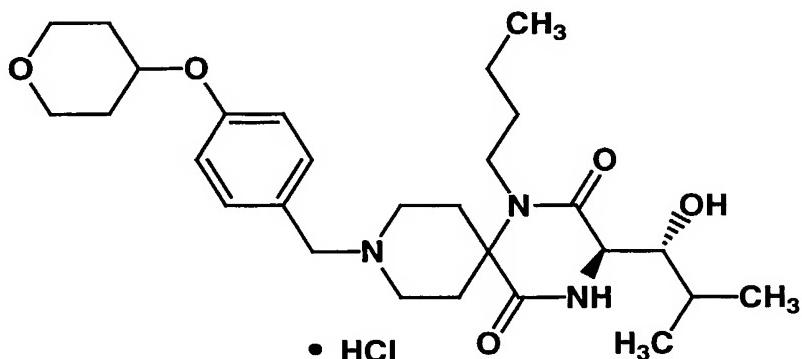
(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル)-9-(4-シクロヘキシリオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩
 15



TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.37 (m, 1H), 4.24 (brs, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.94 (m, 1H), 3.68 (m, 1H), 3.52-5 3.34 (m, 2H), 3.29-3.07 (m, 3H), 2.52-1.92 (m, 7H), 1.85-1.27 (m, 12H), 1.04-0.89 (m, 9H)。

実施例44(6)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.20 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.45 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.67-4.59

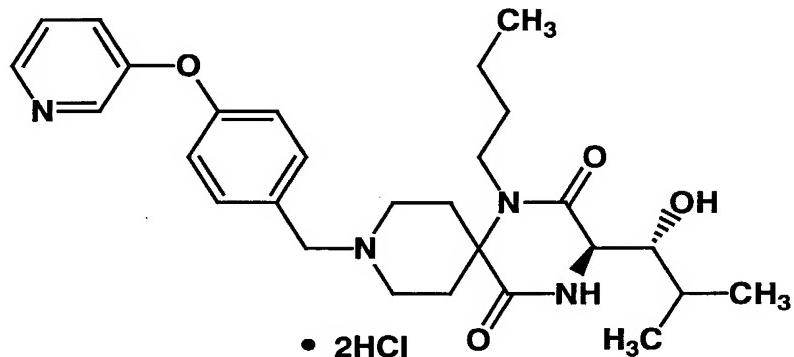
(m, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.00-3.90 (m, 3H), 3.75-3.67 (m, 1H), 3.63-3.53 (m, 2H), 3.50-3.41 (m, 3H), 3.18 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.18 (m, 1H), 2.49-1.96 (m, 7H), 1.77-1.65 (m, 3H), 1.44-1.30 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例4 4 (7)

(3R*)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩

10 酸塩



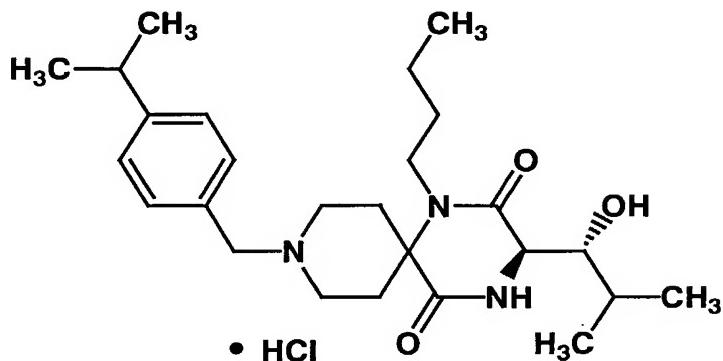
TLC : Rf 0.22 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.76 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 8.29 (dd, J = 9.0, 2.5 Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 9.0, 6.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.35

15 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 3.61-3.47 (m, 3H), 3.20 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 3.20 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.46 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.05-1.95 (m, 1H), 1.69 (m, 1H), 1.41-1.35 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

20 実施例4 4 (8)

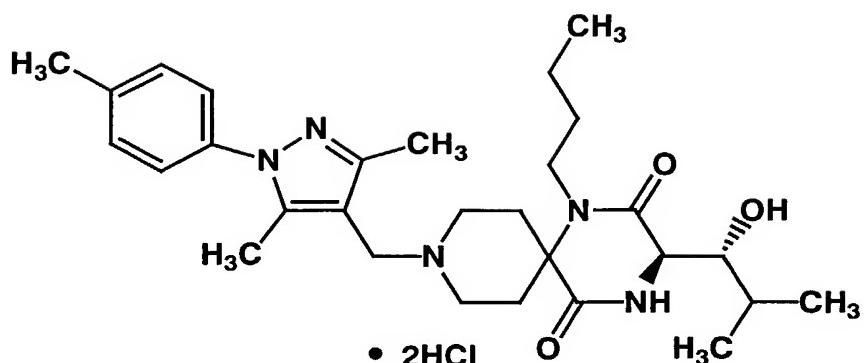
(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



5 TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.05-3.91 (m, 1H), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.57-3.38 (m, 3H), 3.26-3.13 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 3.03-2.86 (m, 1H), 2.53-2.38 (m, 2H), 2.38-2.23 (m, 1H), 2.16-2.05 (m, 1H), 2.06-1.92 (m, 1H), 1.77-1.56 (m, 1H), 1.49-1.26 (m, 3H), 1.25 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 4 4 (9)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 -ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

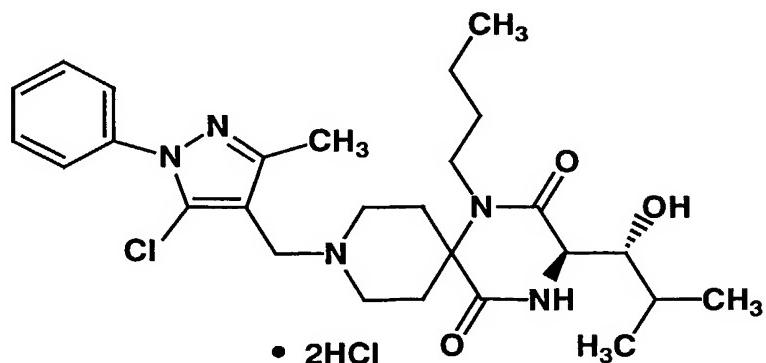


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (s, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.11-3.97 (m, 1H), 3.86-3.72 (m, 1H), 3.64-3.50 (m, 3H), 3.39-3.30 (m, 1H), 3.21 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.55 (m, 1H), 2.53-2.40 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.18-2.07 (m, 1H), 2.07-1.96 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例44(10)

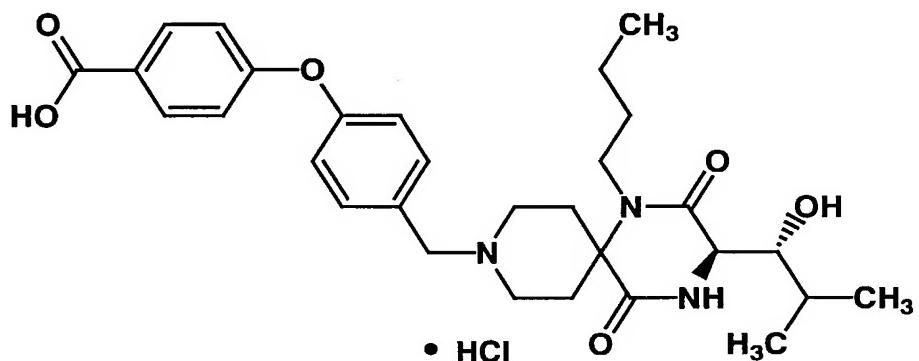
(3R*)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3-メチル-5-クロロ-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.58-7.47 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 4.15-4.02 (m, 1H), 3.89-3.75 (m, 1H), 3.65-3.48 (m, 3H), 3.30-3.20 (m, 1H), 3.20
 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.64-2.46 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.44-2.32 (m, 1H),
 5 2.21-2.10 (m, 1H), 2.08-1.93 (m, 1H), 1.80-1.60 (m, 1H), 1.52-1.30 (m, 3H), 0.99
 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 44 (11)

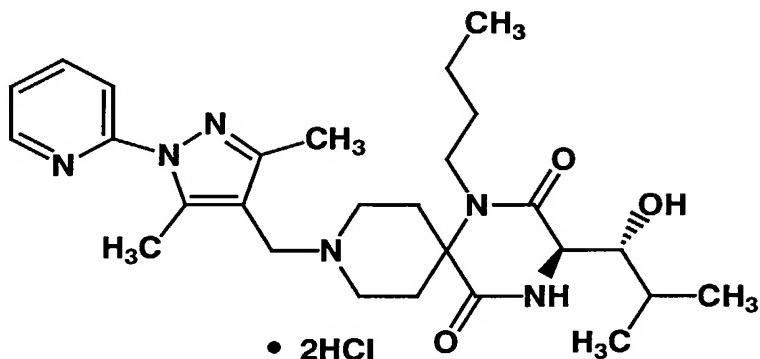
(3R*)-1-ブチル-2-, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロ
 10 キシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)
 フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩
 酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 8.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18 (d, J
 = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 4.10-3.94 (m, 1H), 3.83-3.69 (m, 1H), 3.59-3.40 (m, 3H), 3.25-3.12 (m, 1H), 3.19
 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.55-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.19-2.08 (m,
 1H), 2.08-1.94 (m, 1H), 1.79-1.60 (m, 1H), 1.52-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz,
 20 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例4 4 (1 2)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 , 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン - 5 - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



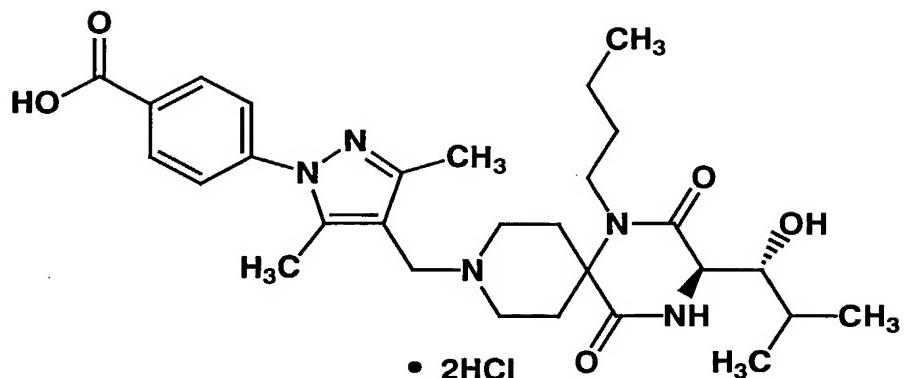
TLC : Rf 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 8.53 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.05 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.81 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.44 (dd, $J = 7.8, 5.1$ Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.16 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.06 (m, 1H), 3.78 (m, 1H), 3.62-3.44 (m, 3H), 3.26 (m, 1H), 3.21 (dd, $J = 9.6, 2.1$ Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 2.60-2.30 (m, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.16 (m, 1H), 2.02 (m, 1H), 1.72 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 1.00 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

15

実施例4 4 (1 3)

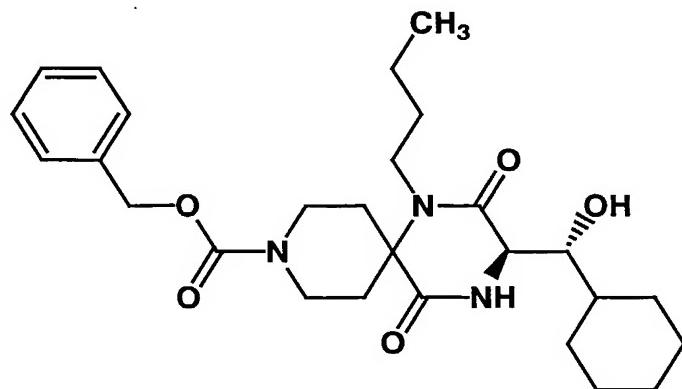
(3 R*) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 , 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 2 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.62 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.12-3.98 (m, 1H), 3.87-3.74 (m, 1H), 3.63-3.45 (m, 5 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.20 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.59-2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.40-2.23 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.23-2.10 (m, 1H), 2.10-1.96 (m, 1H), 1.80-1.62 (m, 1H), 1.52-1.24 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 4 5

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

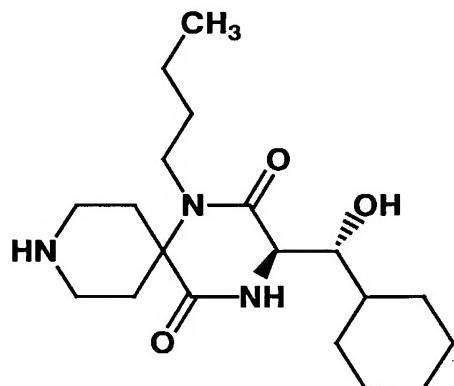


N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシンの代わりに、(2*R*^{*}, 3*R*^{*})-N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシリルプロパン酸を用いて、実施例35と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

5 TLC : R_f 0.53 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.27 (m, 5H), 5.13 (m, 2H), 4.13 (d, J=2.5 Hz, 1H), 4.06-4.02 (m, 2H), 3.78-3.48 (m, 2H), 3.36-3.29 (m, 2H), 3.02 (br, 1H), 2.17 (m, 1H), 2.03-1.58 (m, 10H), 1.47-1.13 (m, 6H), 1.02-0.89 (m, 5H)。

10 実施例46

(3*R*^{*})-1-ブチル-2,5-ジオキゾ-3-((1*R*^{*})-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



15 実施例45で製造した化合物を用いて、実施例9と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

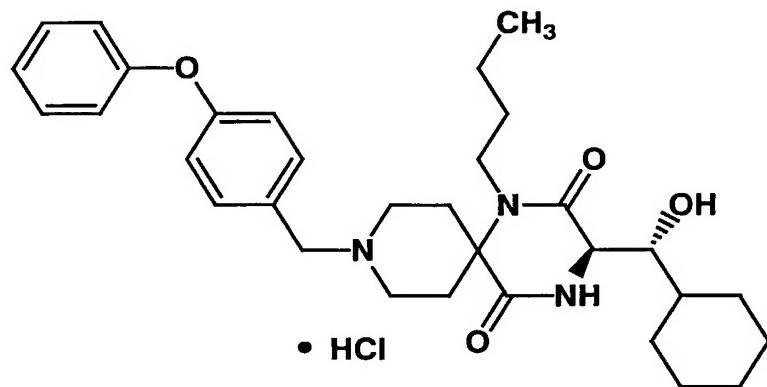
TLC : R_f 0.33 (クロロホルム:メタノール:酢酸=20:6:1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.13 (d, J=2.5 Hz, 1H), 3.48-3.22 (m, 5H), 2.97-2.89 (m, 2H), 2.12-1.65 (m, 10H), 1.56-1.16 (m, 7H), 1.03-0.85 (m, 5H)。

実施例 4 7 (1) ~ 4 7 (8)

実施例 4 6 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

5 実施例 4 7 (1)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

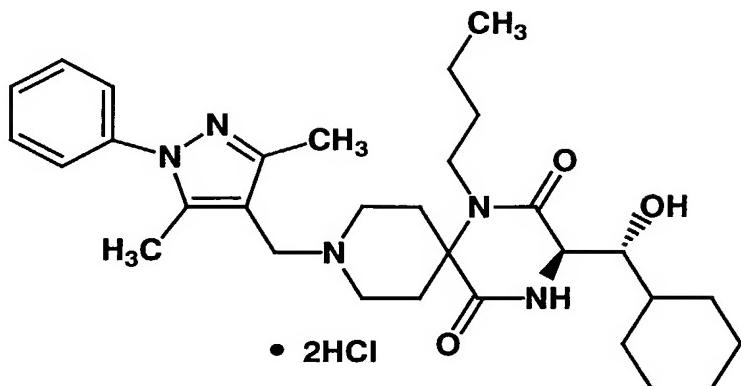


10 TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.55-7.51 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (tt, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.98 (dt, J = 3.5, 12.5 Hz, 1H), 3.73 (dt, J = 3.5, 12.5 Hz, 1H), 3.57-3.39 (m, 3H), 3.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.20 (m, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 2.30 (m, 1H), 2.12 (d, J = 15.5 Hz, 1H), 2.04-1.92 (m, 2H), 1.80-1.62 (m, 5H), 1.48-1.11 (m, 6H), 1.01-0.82 (m, 5H)。
 15

実施例 4 7 (2)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニ

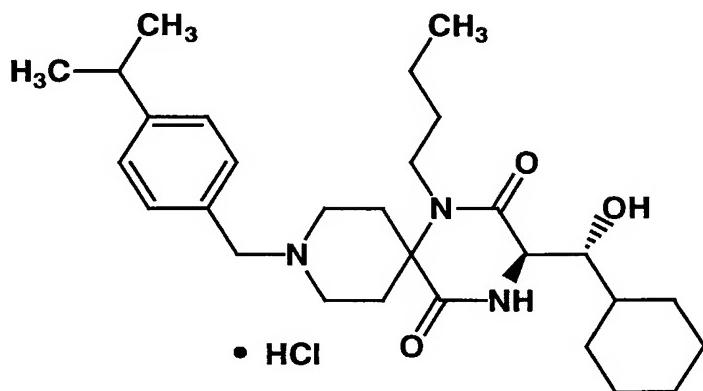
ルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.50 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.17 (d, J = 2.5 Hz, 1H),
 4.04 (m, 1H), 3.85-3.75 (m, 1H), 3.61-3.51 (m, 3H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.62 (m,
 1H), 2.49-2.44 (m, 5H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (m, 1H), 2.05-1.92 (m, 2H), 1.77-1.65
 (m, 5H), 1.44-1.15 (m, 6H), 1.01-0.85 (m, 5H)。

10 実施例47(3)

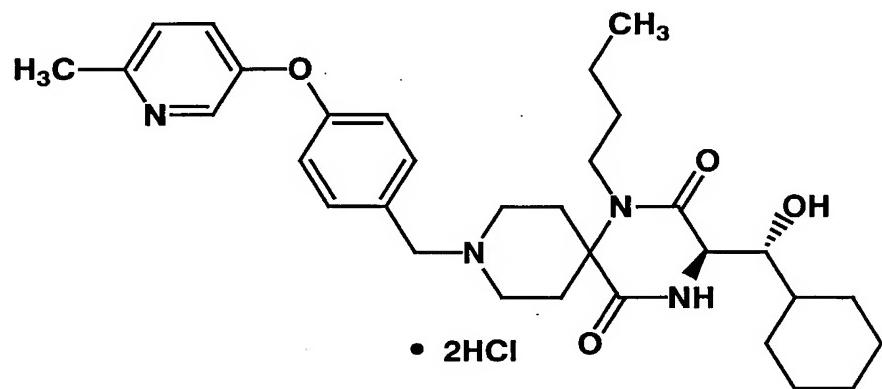
(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.69 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.55-3.40 (m, 3H), 3.29-3.16 (m, 2H), 2.95 (m, 1H), 2.52-2.24 (m, 3H), 2.15-1.86 (m, 3H), 1.80-5 1.60 (m, 5H), 1.48-1.10 (m, 6H), 1.25 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.02-0.82 (m, 5H)。

実施例 4 7 (4)

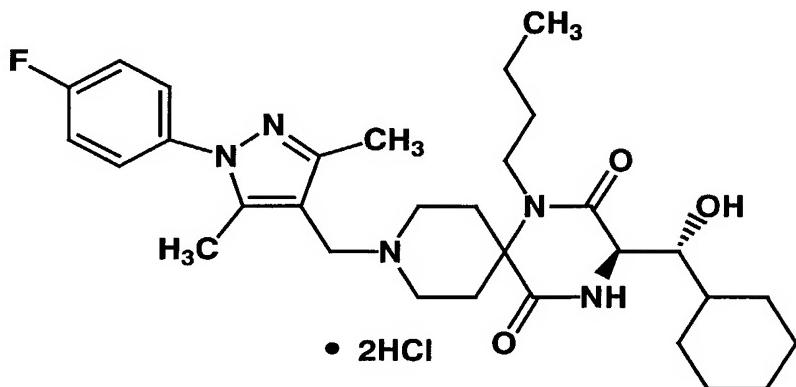
(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(6-メチルピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.51 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.59 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.19 (dd, J = 9.0, 2.7 Hz, 1H), 7.91 15 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.73 (m, 1H), 3.61-3.46 (m, 3H), 3.37-3.26 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.45 (m, 1H), 2.13-1.92 (m, 3H), 1.73 (m, 4H), 1.40-1.14 (m, 8H), 1.01-0.86 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 4 7 (5)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-フルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

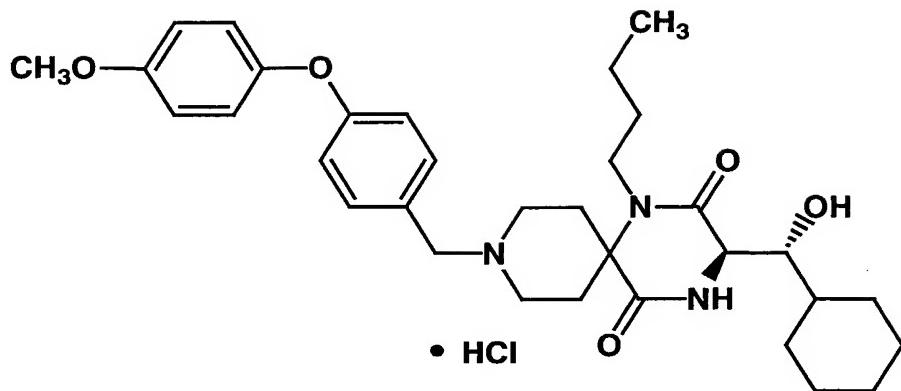


5

TLC : Rf 0.49 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.57 (m, 2H), 7.37-7.31 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 4.08-4.00 (m, 1H), 3.79 (m, 1H), 3.63-3.52 (m, 3H), 3.37-3.27 (m, 2H), 2.65 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.45 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.16-1.92 (m, 3H),
 10 1.73 (m, 4H), 1.42-1.15 (m, 8H), 1.01-0.88 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H)。

実施例47(6)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル)-9-(4-(4-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

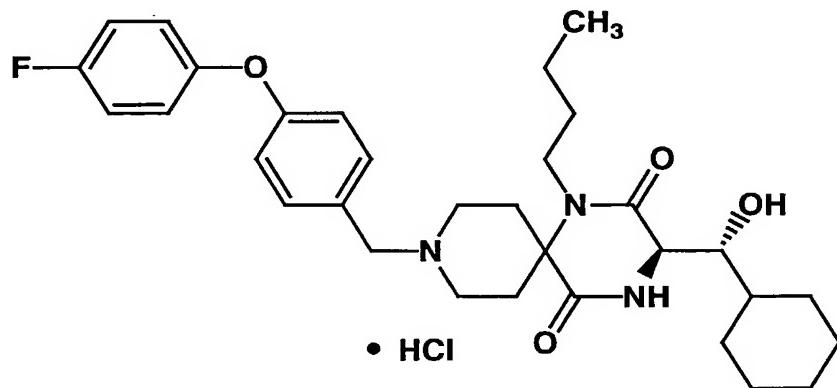


TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.99-6.92 (m, 4H), 4.30 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.72 (m, 1H), 3.58-3.38 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.54-1.88 (m, 6H), 1.82-1.60 (m, 5H), 1.50-1.10 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 47 (7)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(4-フルオロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

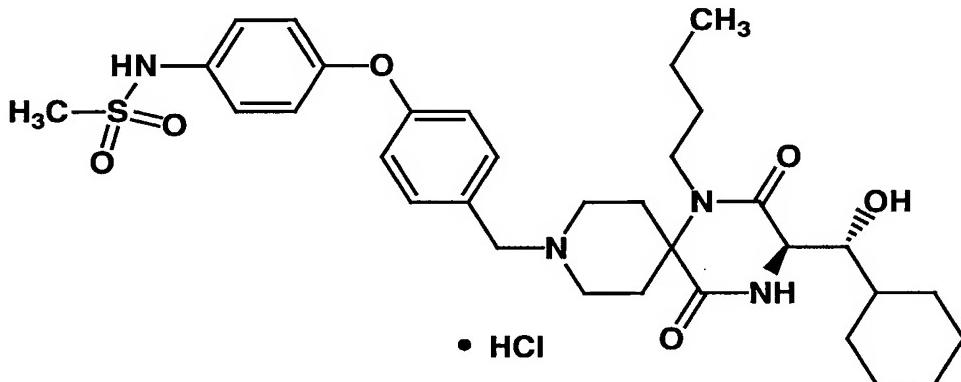
NMR (CD_3OD) : δ 7.51 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.13 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.10 - 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.16 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.56-1.88 (m, 6H), 1.82-1.60 (m, 5H), 1.54-1.10 (m, 6H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

5

実施例 4 7 (8)

(3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.

10 5] ウンデカン・塩酸塩



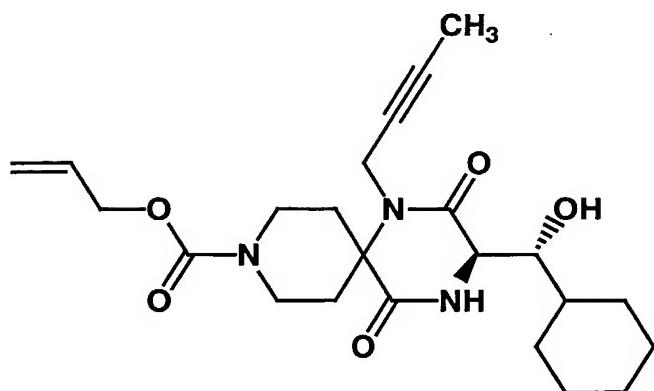
TLC : Rf 0.52 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.53 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.08 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.04 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.16 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.54-1.88 (m, 6H), 1.82-1.62 (m, 5H), 1.50-1.14 (m, 6H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 4 8

20 (3 R*)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-((1 R*)-

1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-9-アリルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン



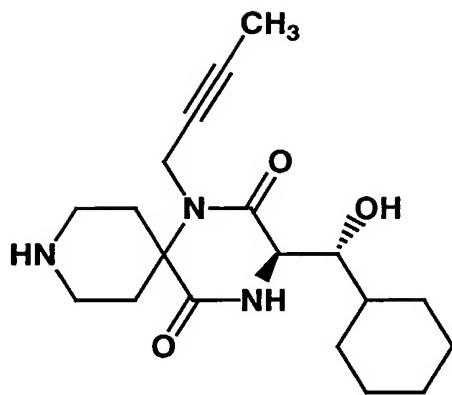
参考例2で製造した樹脂(3)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペ
5 リドン、2-ブチニルアミン、(2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシ
カルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシリルプロパン
酸を用いて、参考例3→参考例6→実施例1と同様の操作をし、以下の物性
値を有する本発明化合物を得た。

TLC : Rf 0.32 (クロロホルム:メタノール=15:1) ;
10 NMR (CD₃OD) : δ 6.04-5.91 (m, 1H), 5.35-5.27 (m, 1H), 5.23-5.19 (m, 1H),
4.60-4.58 (m, 2H), 4.27 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.07-
4.01 (m, 2H), 3.89 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 3.75-3.50 (m, 2H), 3.38 (dd, J = 9.0,
2.5 Hz, 1H), 2.32-2.17 (m, 2H), 2.07-1.70 (m, 11H), 1.33-1.14 (m, 3H), 1.00-0.85
(m, 2H)。

15

実施例4.9

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-
1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
ロ[5. 5]ウンデカン



実施例 4 8 で製造した化合物を用いて、参考例 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

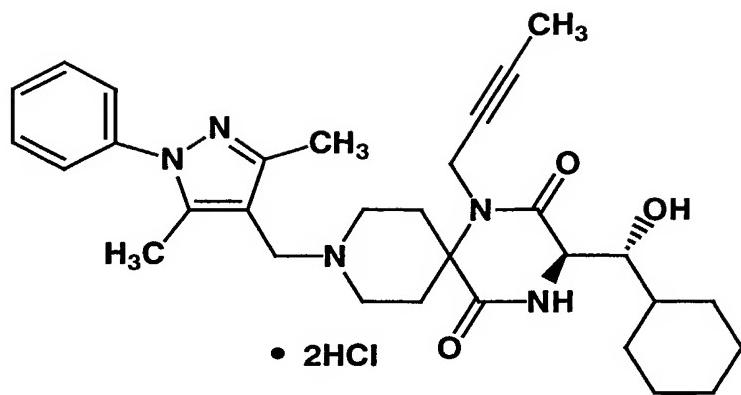
TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 6 : 1) ;
 5 NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 4.18 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.03 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 3.48-3.29 (m, 3H), 2.99-2.90 (m, 2H), 2.26-1.73 (m, 14H), 1.32-1.18 (m, 3H), 1.01-0.91 (m, 2H)。

実施例 5 0 (1) ~ 5 0 (6)

10 実施例 4 9 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 0 (1)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2 塩酸塩
 15

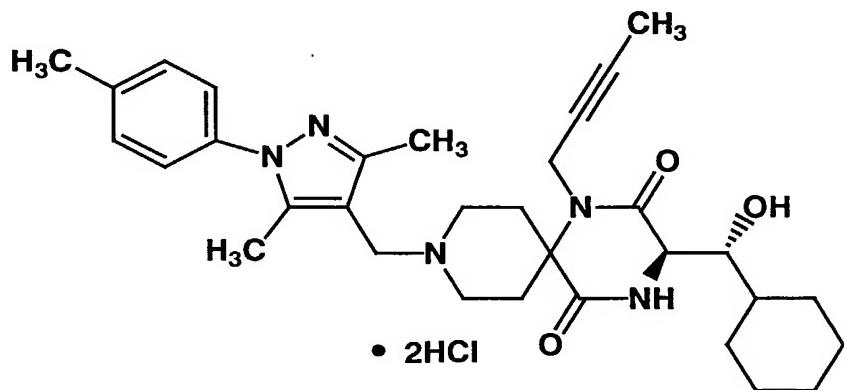


TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.50 (m, 5H), 4.42-4.33 (m, 3H), 4.21 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.08-3.99 (m, 2H), 3.85-3.75 (m, 1H), 3.65-3.57 (m, 2H), 3.32 (m, 1H), 2.79 (m, 1H), 2.48-2.43 (m, 5H), 2.40 (s, 3H), 2.22 (m, 1H), 2.05-1.93 (m, 2H), 1.80-1.64 (m, 7H), 1.39-1.11 (m, 3H), 1.03-0.84 (m, 2H)。

実施例 50 (2)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

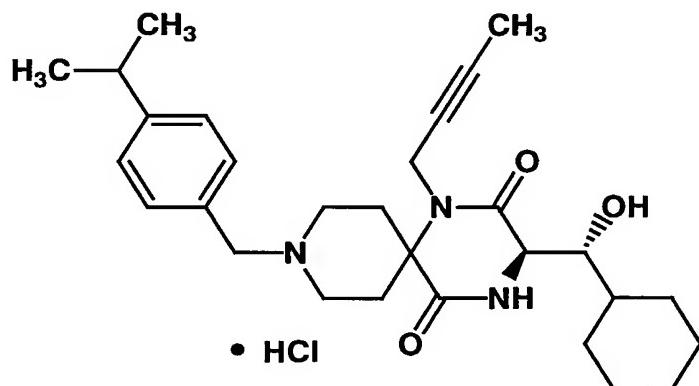
NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (s, 4H), 4.45-4.30 (m, 3H), 4.20 (m, 1H), 4.16-3.98 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.68-3.56 (m, 2H), 3.30 (m, 1H), 2.82 (m, 1H), 2.56-2.42 (m, 8H), 2.39 (s, 3H), 2.28-1.88 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 3H), 1.12-0.82 (m, 2H)。

5

実施例 5 0 (3)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸

10 塩



TLC : Rf 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.38-4.28

(m, 3H), 4.17 (m, 1H), 4.04-3.88 (m, 2H), 3.74 (m, 1H), 3.50-3.40 (m, 2H), 3.28

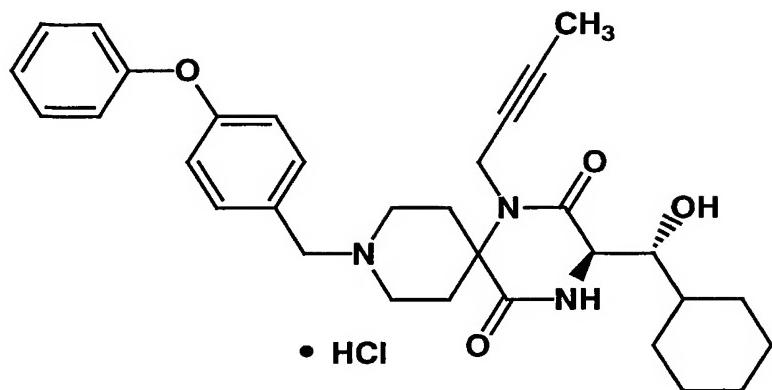
15 (m, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.64 (m, 1H), 2.50-1.86 (m, 5H), 1.80-1.62 (m, 7H), 1.36-1.04 (m, 3H), 1.25 (d, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00-0.82 (m, 2H)。

実施例 5 0 (4)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-

20 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-9-(4-フェニルオキシ

フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

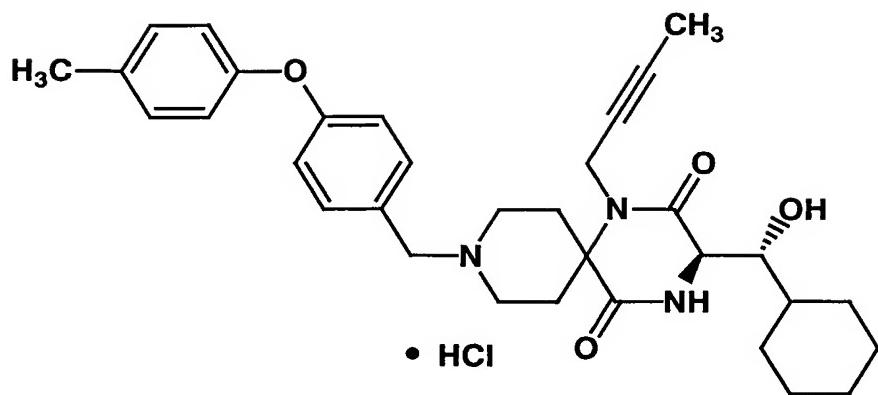


TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.42-7.37 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.06-7.02 (m, 4H), 4.40-4.30 (m, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.04-3.90 (m, 2H), 3.72 (m, 1H), 3.30-3.20 (m, 2H), 3.28 (m, 1H), 2.68 (m, 1H), 2.52-1.86 (m, 5H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.38-1.10 (m, 3H), 1.02-0.82 (m, 2H)。

10 実施例 50 (5)

(3R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5: 5] ウンデカン・塩酸塩

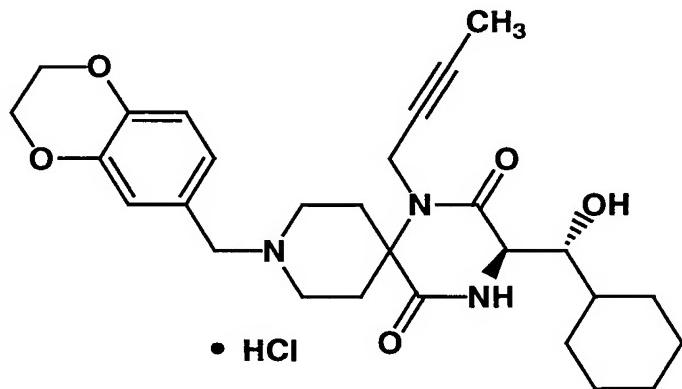


TLC : R_f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40-4.28 (m, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.04-5.38 (m, 2H), 3.74 (m, 1H), 3.52-3.40 (m, 2H), 3.26 (m, 1H), 2.64 (m, 1H), 2.54-1.86 (m, 5H), 2.33 (s, 3H), 1.80-1.62 (m, 7H), 1.38-1.10 (m, 3H), 1.02-0.82 (m, 2H)。

実施例 50 (6)

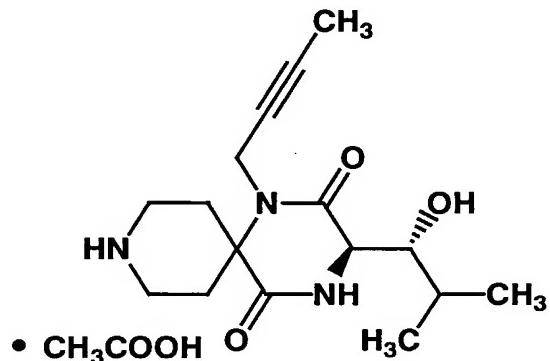
10 (3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (s, 1H), 6.99-6.91 (m, 2H), 4.35 (m, 1H), 4.27 (s, 4H),
 4.24 (s, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.04-3.84 (m, 2H), 3.70 (m, 1H), 3.56-3.38 (m, 2H),
 3.28 (m, 1H), 2.68-1.88 (m, 6H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 3H), 1.02-
 5 0.80 (m, 2H)。

実施例 5 1

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.10.5]ウンデカン・酢酸塩



(2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシリルプロパン酸の代わりに、(2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸を用いて、実施例48→実施例49と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.22 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 6 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.36 (dq, J = 17.0, 2.5 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 2.0 Hz, 1H),
 3.95-3.79 (m, 2H), 3.62 (dt, J = 3.5, 13.0 Hz, 1H), 3.34-3.26 (m, 2H), 3.22 (dd, J =
 20 9.5, 2.0 Hz, 1H), 2.54-2.43 (m, 1H), 2.37 (m, 1H), 2.20-1.98 (m, 3H), 1.91 (s,

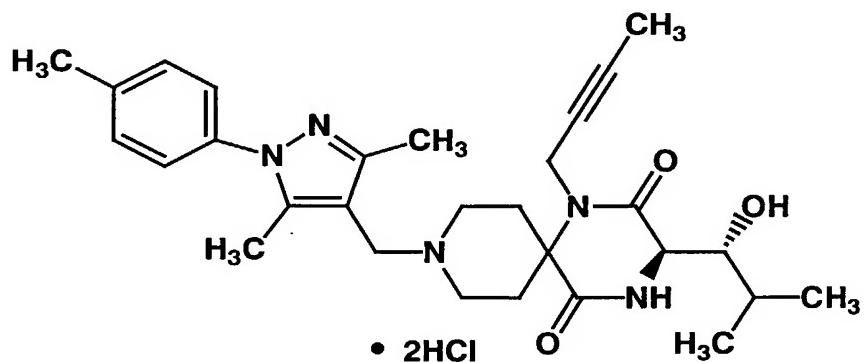
3H), 1.75 (t, J = 2.5 Hz, 3H), 1.01-0.97 (m, 6H)。

実施例 5 2 (1) ~ 5 2 (5)

実施例 5 1 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施
5 例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 2 (1)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



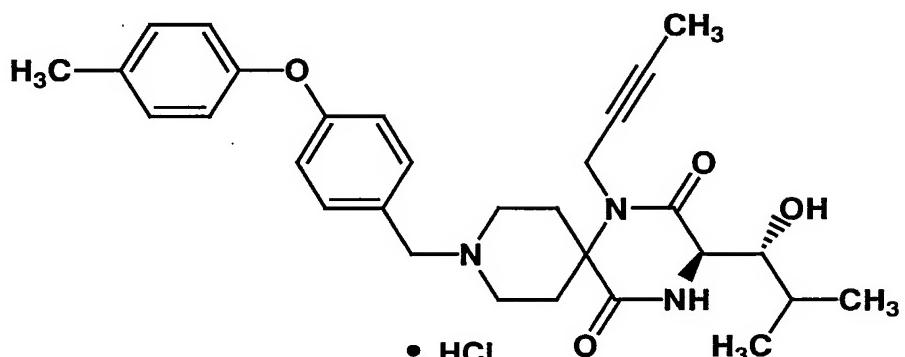
TLC : Rf 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.38 (d, J = 3.9 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 3.9 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.10-3.90 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.68-3.52 (m, 2H), 3.22 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.74 (m, 1H), 2.54-2.20 (m, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.98 (m, 1H), 1.75 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

20 実施例 5 2 (2)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

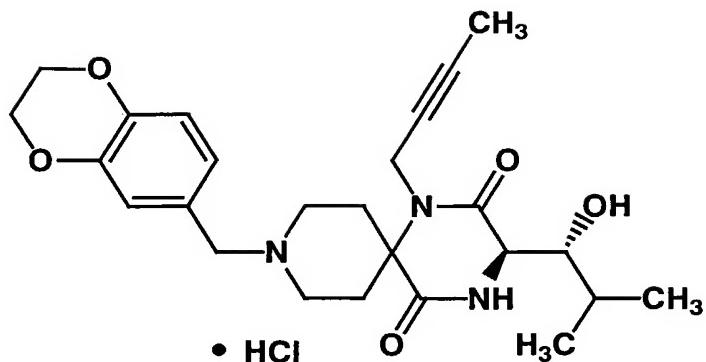
5



TLC : R_f 0.26 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.82 (m, 2H), 3.76 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 2H), 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.42 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.35-2.18 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 5 2 (3)

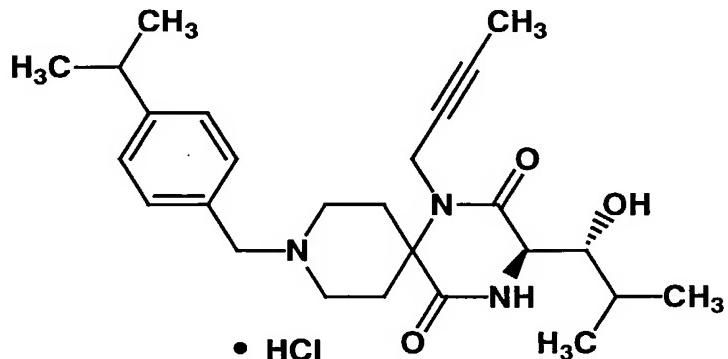
(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.92 (m, 3H), 4.38 (m, 1H), 4.28 (s, 4H), 4.25 (s, 2H),
 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.02-3.84 (m, 2H), 3.70 (m, 1H), 3.52-3.36 (m, 2H),
 5 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.60 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.32-2.16 (m, 2H),
 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz,
 3H)。

実施例 5 2 (4)

10 (3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



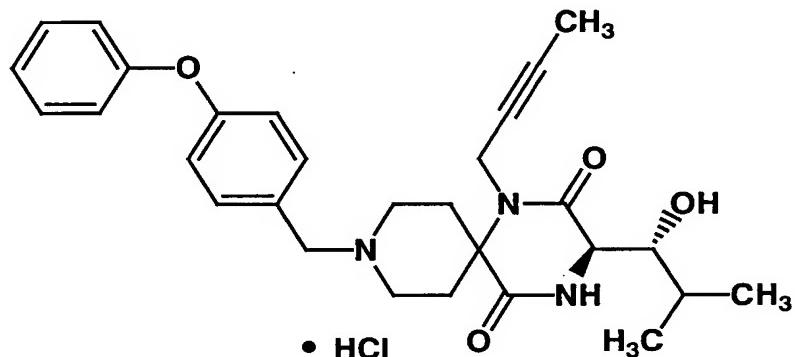
TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.40 (m,

1H), 4.33 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.84 (m, 2H), 3.76 (m, 1H), 3.52-3.40 (m, 2H), 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.96 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.36-2.12 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.24 (d, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5

実施例 5 2 (5)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

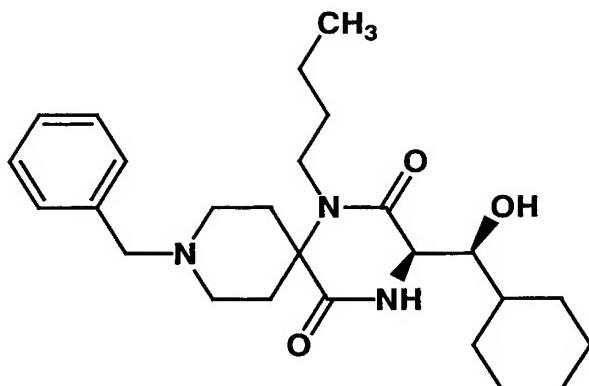
TLC : Rf 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.41 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 7.19 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 4H), 4.40 (m, 1H), 4.35 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.84 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 2H), 3.21 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.42 (m, 2H), 2.38-2.18 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 5 3

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザ

スピロ [5. 5] ウンデカン

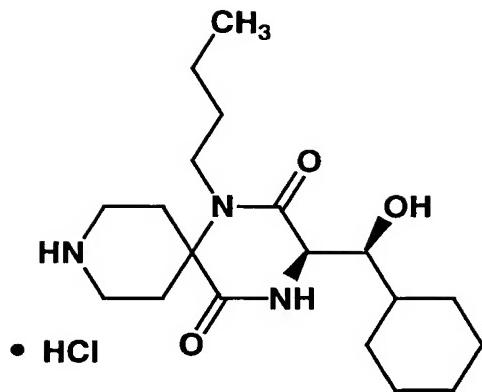


参考例 2 で製造した樹脂（3）、N-ベンジル-4-ピペリドン、n-ブチルアミン、（2 R*, 3 S*）-N-（t-ブチルオキシカルボニル）-2
5 -アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシリルプロパン酸を用いて、参考
例 3 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明
化合物を得た。

TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.20 (m, 5H), 4.04 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.65-3.45 (m,
10 2H), 3.57 (s, 2H), 3.30 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.86-2.77 (m, 3H), 2.30-2.00 (m,
4H), 1.90-1.60 (m, 6H), 1.60-1.10 (m, 9H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz,
3H)。

実施例 5.4

15 (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-ヒドロ
キシ-1-シクロヘキシリルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン・塩酸塩



実施例 5 3 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 2 : 1) ;

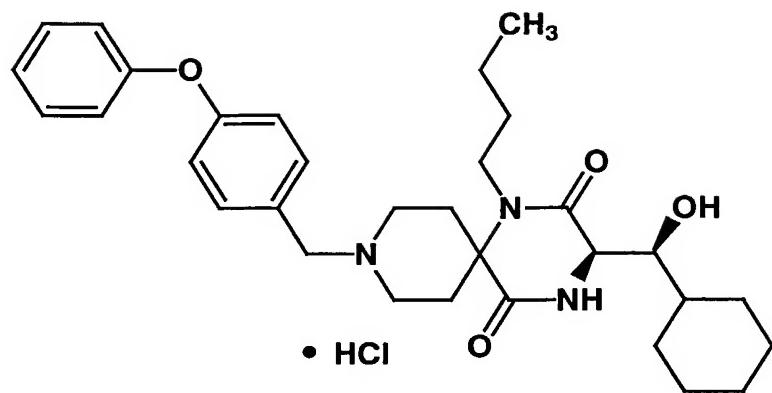
NMR (CD_3OD) : δ 4.08 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.70-3.12 (m, 7H), 2.50-2.02 (m, 5H), 1.85-1.66 (m, 5H), 1.55-1.10 (m, 7H), 1.10-0.85 (m, 2H), 0.97 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H)。

実施例 5 5 (1) ~ 5 5 (3)

実施例 5 4 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 5 (1)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

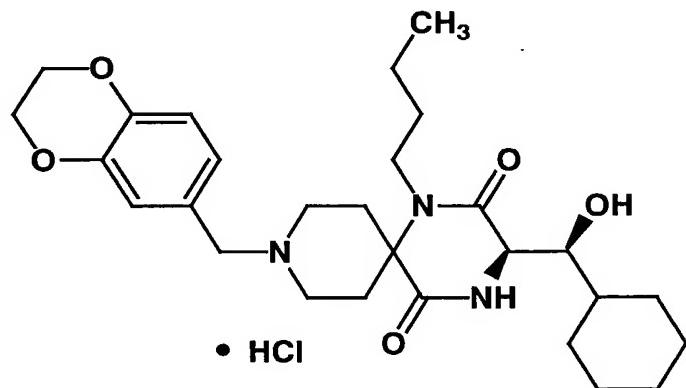


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.30 (brs, 2H), 4.08 (d, J = 1.2 Hz, 1H),
5 4.04 (m, 1H), 3.74-3.36 (m, 5H), 3.16 (m, 1H), 2.55-2.33 (m, 2H), 2.32-2.09 (m, 2H), 2.04 (m, 1H), 1.84-1.61 (m, 5H), 1.53-1.12 (m, 7H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 5 5 (2)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリルメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

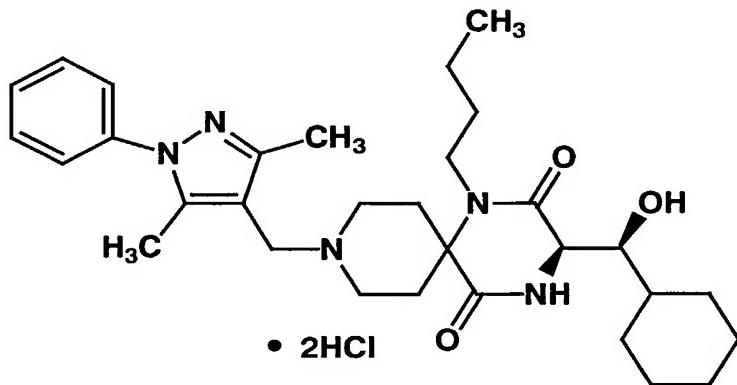
NMR (CD_3OD) : δ 7.04 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.21 (s, 2H), 4.07 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.70-3.34 (m, 5H), 3.16 (m, 1H), 2.53-2.32 (m, 2H), 2.31-2.08 (m, 2H), 2.03 (m, 1H), 1.84-1.60 (m, 5H), 1.52-1.12 (m, 7H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

5

実施例 5 5 (3)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]

10 ウンデカン・2塩酸塩



TLC : Rf 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

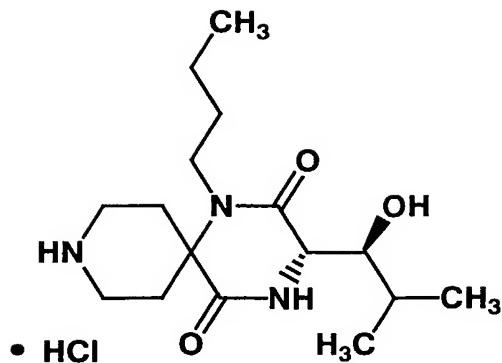
NMR (CD_3OD) : δ 7.61-7.44 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 2H), 3.73 (m, 1H), 3.66-3.52 (m, 4H), 3.26 (m, 1H), 2.62-2.48 (m, 2H), 2.45-2.30 (m, 7H), 2.19

15 (m, 1H), 2.04 (m, 1H), 1.84-1.63 (m, 5H), 1.54-1.12 (m, 7H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

実施例 5 6

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデ

20 カン・塩酸塩



(2R*, 3R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸の代わりに、(2S, 3S) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 4 2 → 実施例 4 3 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : Rf 0.08 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 4.15 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 3.96 (dt, $J = 13.0, 4.0$ Hz, 1H), 3.71 (dt, $J = 13.0, 4.0$ Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H), 1.07-0.94 (m, 9H) ;
 比旋光度 : $[\alpha]_D -13.8$ (c 1.00, メタノール) 。

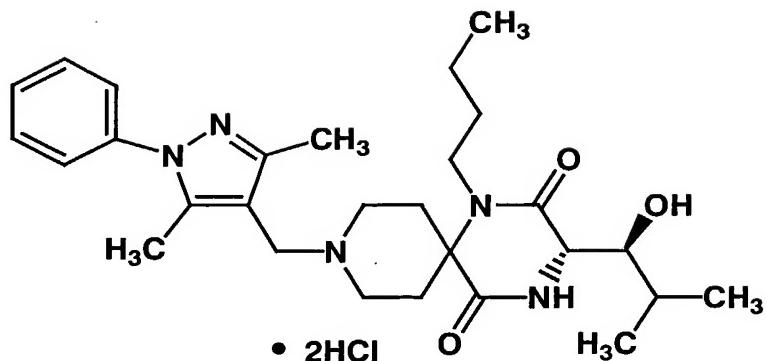
実施例 5 7 (1) ~ 5 7 (4)

実施例 5 6 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 7 (1)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ

ン・2 塩酸塩

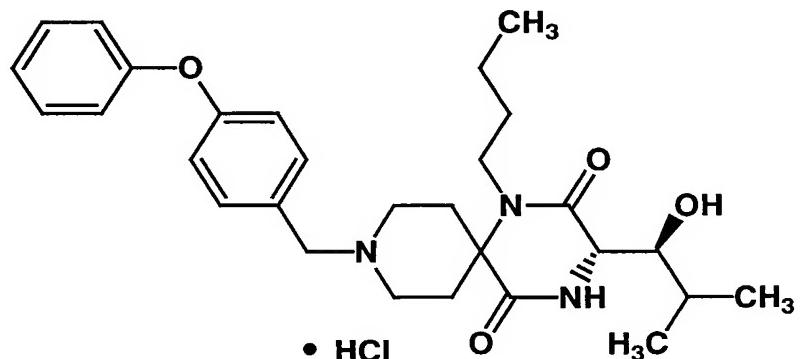


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
5 4.12-3.99 (m, 1H), 3.90-3.72 (m, 1H), 3.64-3.44 (m, 3H), 3.30-3.12 (m, 1H), 3.20
(dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.60-2.30 (m, 9H), 2.24-2.10 (m, 1H), 2.10-1.95 (m,
1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.54-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J =
6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

10 実施例 5 7 (2)

(3S)-1-(2-methylpropyl)-5-oxo-3-((1S)-1-hydroxy-2-methylpropyl)-2-(4-phenyl-1-methyl-1H-pyrazin-2-yl)-1,4,9-triazaaspiro[5.5]undecan・塩酸塩

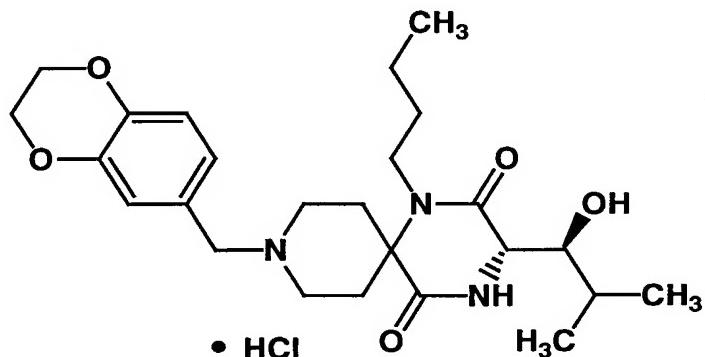


15 TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.52 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, $J = 9.6, 2.1$ Hz, 1H), 2.53-2.37 (m, 2H), 2.37-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.06-1.95 (m, 1H), 5 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 5 7 (3)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

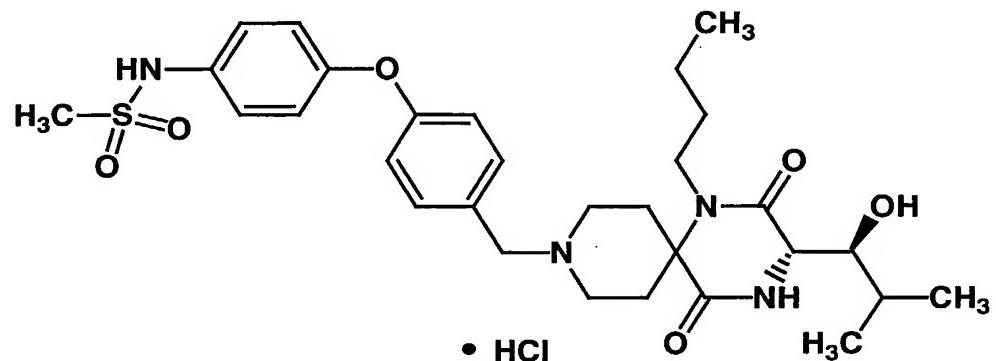


TLC : Rf 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.06 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 4.02-3.87 (m, 1H), 3.77-3.62 (m, 1H), 3.57-3.35 (m, 3H), 3.28-3.08 (m, 1H), 3.19 (dd, $J = 9.6, 2.4$ Hz, 1H), 2.51-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 2.05-1.90 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.98 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 15 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 5 7 (4)

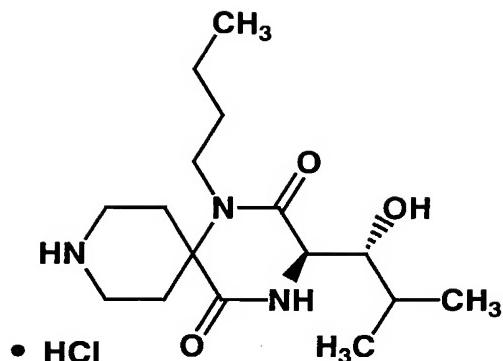
(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.10-7.00
 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m,
 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.25-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.95 (s,
 3H), 2.54-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.08-1.92 (m, 1H),
 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.28 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz,
 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15 実施例 5 8

(3R) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



(2R*, 3R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸の代わりに、(2R, 3R) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 4 2 → 実施例 4 3 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : Rf 0.08 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 4.15 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 3.96 (dt, $J = 13.0, 4.0$ Hz, 1H), 3.71 (dt, $J = 13.0, 4.0$ Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H), 1.07-0.94 (m, 9H) ;
 比旋光度 : $[\alpha]_D +13.9$ (c 1.00, メタノール) 。

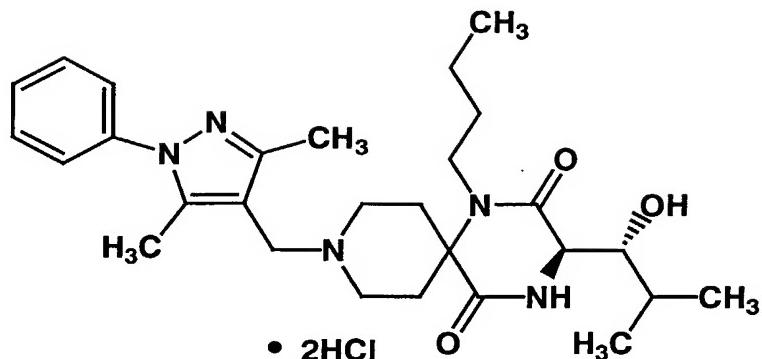
実施例 5 9 (1) ~ 5 9 (4)

実施例 5 8 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 9 (1)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカ

ン・2 塩酸塩



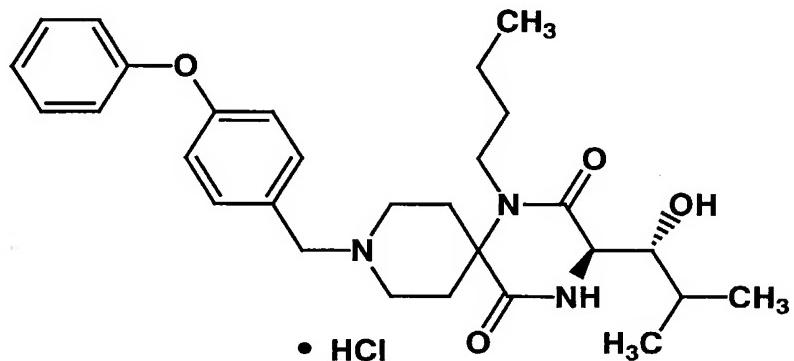
TLC : Rf 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.61-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H),

5 4.12-3.99 (m, 1H), 3.90-3.72 (m, 1H), 3.64-3.44 (m, 3H), 3.30-3.12 (m, 1H), 3.20
(dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.60-2.30 (m, 9H), 2.24-2.10 (m, 1H), 2.10-1.95 (m,
1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.54-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J =
6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

10 実施例 5 9 (2)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

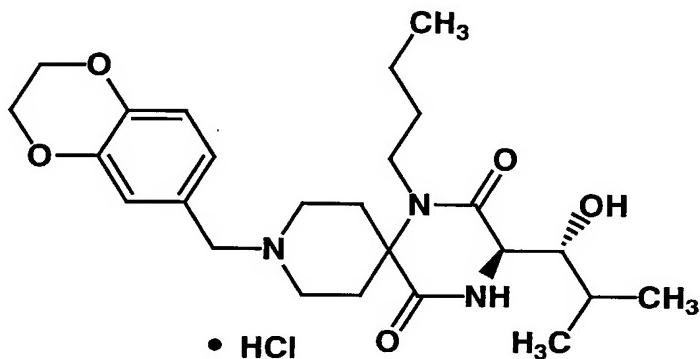


15 TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.52 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, $J = 9.6, 2.1$ Hz, 1H), 2.53-2.37 (m, 2H), 2.37-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.06-1.95 (m, 1H),
 5 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 5 9 (3)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

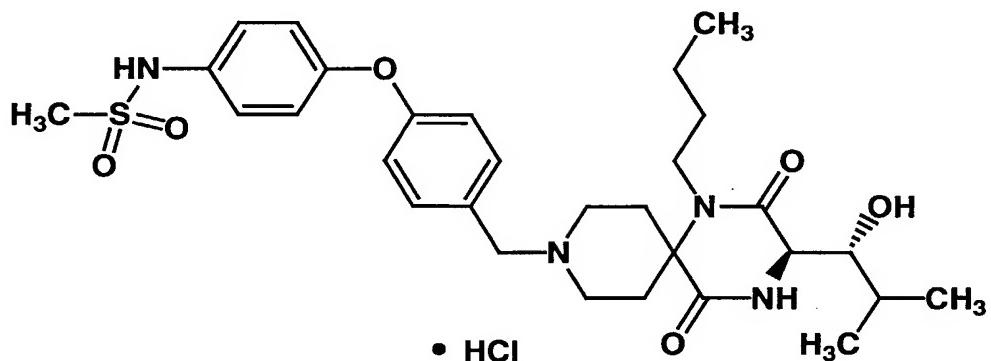


TLC : Rf 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.06 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 4.02-3.87 (m, 1H), 3.77-3.62 (m, 1H), 3.57-3.35 (m, 3H), 3.28-3.08 (m, 1H), 3.19 (dd, $J = 9.6, 2.4$ Hz, 1H), 2.51-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 2.05-1.90 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.98 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 5 9 (4)

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

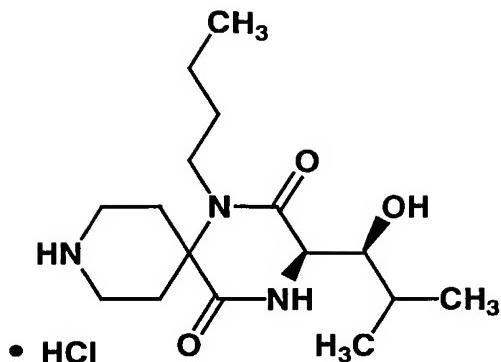


TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.25-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.54-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.08-1.92 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.28 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15 実施例 6 0

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



(2 R*, 3 S*) - N - (t - プチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 3 - シクロヘキシリルプロパン酸の代わりに、(2 R, 3 S) - N - (t - プチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4
5 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 5 3 → 実施例 5 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

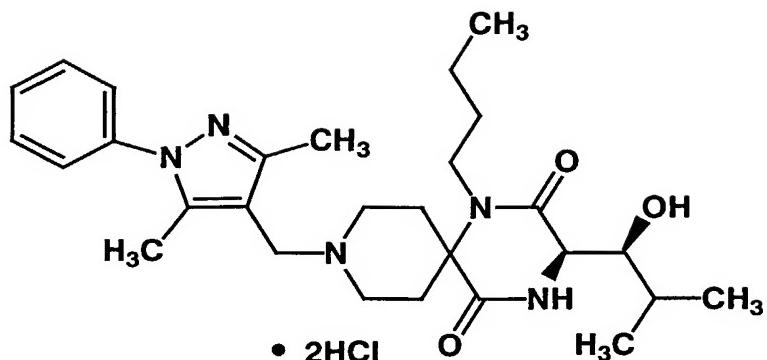
TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 2 : 1) ;
NMR (CD_3OD) : δ 4.08 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 4.02 (dt, $J = 12.6, 3.9$ Hz, 1H),
3.70-3.00 (m, 6H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.80-1.60 (m, 2H), 1.55-1.35 (m, 3H), 1.02
10 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.99 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H) ;
比旋光度 : $[\alpha]_D +21.2$ (c 1.00、メタノール) 。

実施例 6 1 (1) ~ 6 1 (3)

実施例 6 0 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施
15 例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 6 1 (1)

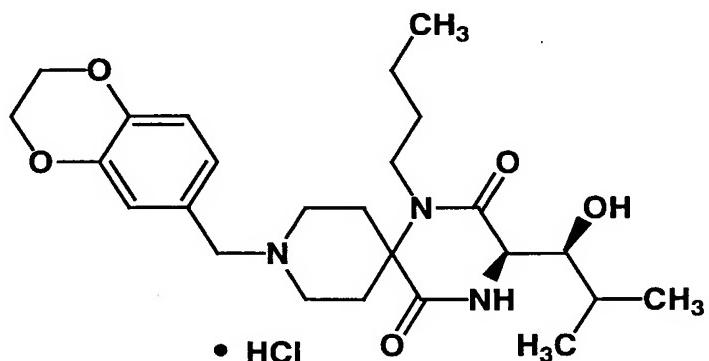
(3 R) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキ
シ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾ
20 ル - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ
ン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.64-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 1H), 4.10 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.80-3.53 (m, 4H), 3.51 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.40-3.20 (m, 1H), 2.70-2.30 (m, 9H), 2.23-2.10 (m, 1H), 1.83-1.60 (m, 2H), 1.53-1.30 (m, 3H), 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 6 1 (2)

(3R)-1-(2-methylpropyl)-5-((1S)-1-hydroxy-2-methylpropyl)-3-(1-methyl-4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08-3.96

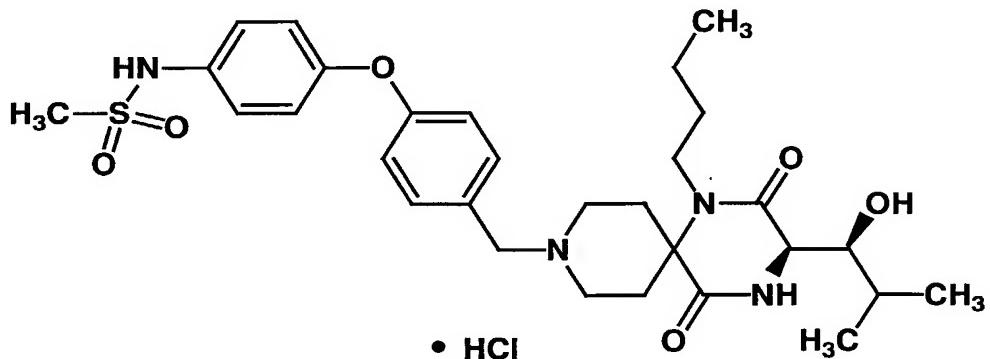
(m, 1H), 3.72-3.35 (m, 4H), 3.49 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.28-3.08 (m, 1H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 1.82-1.62 (m, 2H), 1.52-1.25 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5

実施例 6 1 (3)

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウ

10 ヌンデカン・塩酸塩



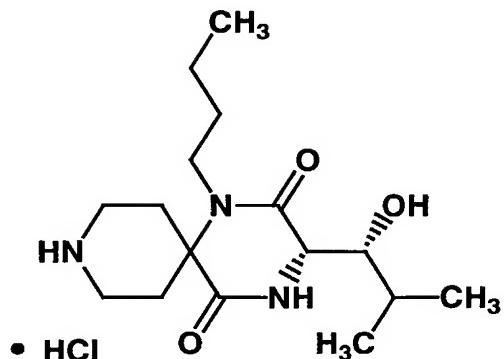
TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.13-4.00 (m, 1H), 4.09 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.75-3.62 (m, 1H), 3.62-3.39 (m, 3H), 3.49 (dd, J = 10.5, 1.5 Hz, 1H), 3.26-3.12 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.56-2.37 (m, 2H), 2.37-2.20 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

15
0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

20 実施例 6 2

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



5 (2R*, 3S*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 3 - シクロヘキシリルプロパン酸の代わりに、(2S, 3R) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 5 3 → 実施例 5 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

10 TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 2 : 1) ; NMR (CD_3OD) : δ 4.08 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 4.02 (dt, $J = 12.6, 3.9$ Hz, 1H), 3.70-3.00 (m, 6H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.80-1.60 (m, 2H), 1.55-1.35 (m, 3H), 1.02 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.99 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H) ; 比旋光度 : $[\alpha]_D -23.4$ (c 1.00、メタノール)。

15

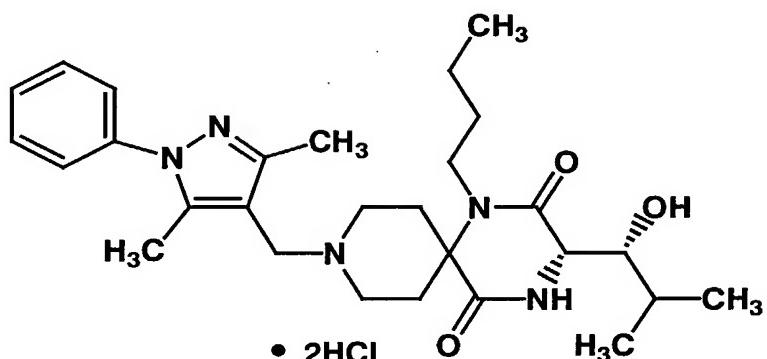
実施例 6 3 (1) ~ 6 3 (3)

実施例 6 2 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

20 実施例 6 3 (1)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 , 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩

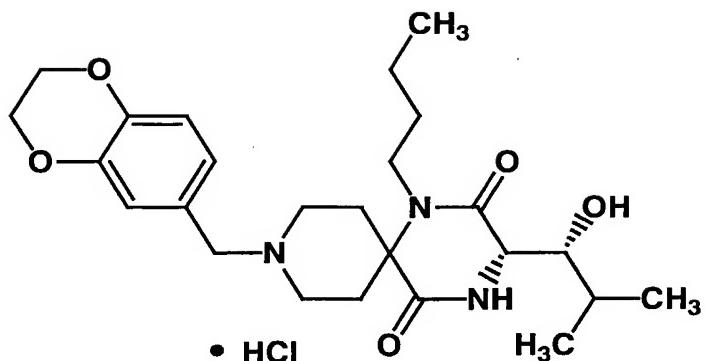
5



TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.64-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 1H), 4.10 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.80-3.53 (m, 4H), 3.51 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.40-3.20 (m, 1H), 2.70-2.30 (m, 9H), 2.23-2.10 (m, 1H), 1.83-1.60 (m, 2H), 1.53-1.30 (m, 3H), 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 6 3 (2)

(3S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1 , 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

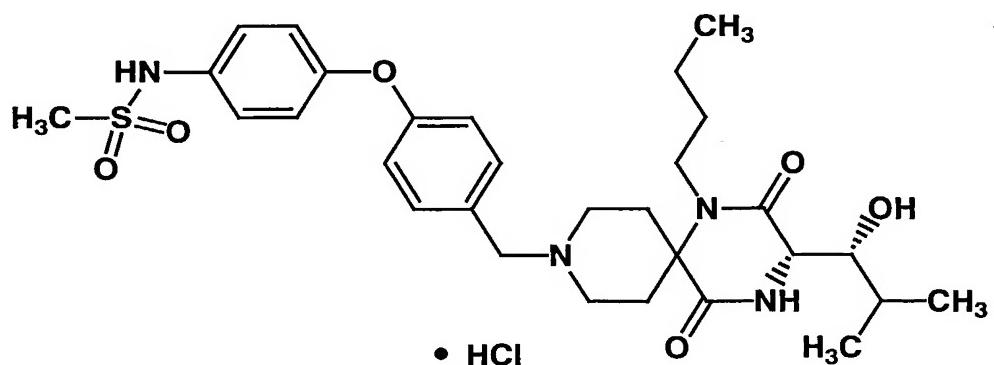


TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08-3.96 (m, 1H), 3.72-3.35 (m, 4H), 3.49 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.28-3.08 (m, 1H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 1.82-1.62 (m, 2H), 1.52-1.25 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

10 実施例 6 3 (3)

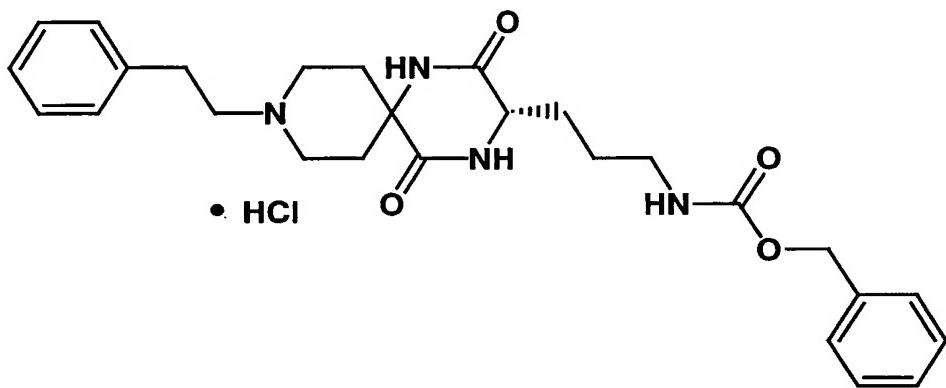
(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウニデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.13-4.00 (m, 1H), 4.09 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.75-3.62 (m, 1H), 3.62-3.39 (m, 3H), 3.49 (dd, J = 10.5, 1.5 Hz, 1H), 3.26-3.12 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.56-2.37 (m, 2H), 2.37-2.20 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 6.4

(3S)-2,5-ジオキソ-3-(3-ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



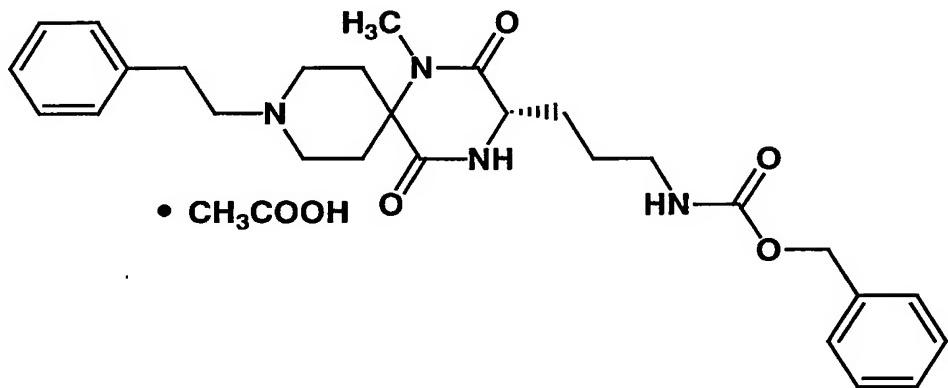
参考例 2 で合成した樹脂(3)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン、2,4,6-トリメトキシベンジルアミンおよびN^α-(t-ブチルオキシカルボニル)-N^δ-(ベンジルオキシカルボニル)-L-オルニチンを用いて、参考例 9→参考例 10→実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (DMSO-d₆) : δ 10.80 - 10.00 (m, 1H), 8.65 - 8.45 (m, 1H), 8.33 (s, 1H),

7.50 - 7.20 (m, 10H), 5.01 (s, 2H), 4.01 (m, 1H), 3.70 - 3.45 (m, 3H), 3.45 - 3.20 (m, 3H), 3.15 - 2.90 (m, 4H), 2.50 - 2.30 (m, 2H), 2.10 - 1.90 (m, 1H), 1.87 - 1.60 (m, 3H), 1.60 - 1.35 (m, 2H)。

5 実施例 6.5

(3S)-1-メチル-2,5-ジオキソ-3-(3-ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



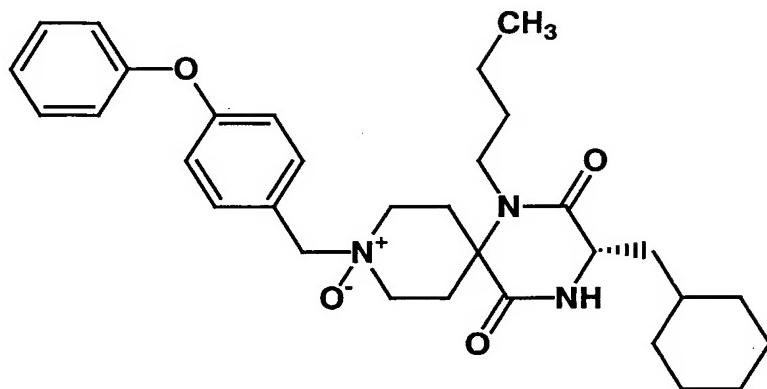
10 参考例 2 で合成した樹脂(3)、N-(2-フェニルエチル)-4-ビペリドン、メチルアミンおよびN^a-(t-ブチルオキシカルボニル)-N^b-(ベンジルオキシカルボニル)-L-オルニチンを用いて、実施例 1.9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 15 MS (ESI, Pos., 40 V) : 493 (M + H)⁺ ;
 HPLC 条件 : F ;
 HPLC 保持時間 : 3.36 分。

実施例 6.6

20 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9

-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-9-オキシド-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



実施例 40 (90) で製造した化合物 (104mg) のアセトン (4ml)
5 溶液に、水 (1ml)、炭酸水素ナトリウム (210mg)、オキソン (6
15mg) (商品名) を加えた。反応混合物を室温で1時間攪拌した。反応
混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナ
トリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。残渣
を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 30 : 1,
10 20 : 1) によって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物 (73mg)
を得た。

TLC : Rf 0.50 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
NMR (CDCl_3) : δ 7.49 (dt, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 2H), 7.36 (ddt, $J = 8.7, 7.2, 2.1$ Hz,
2H), 7.14 (tt, $J = 7.2, 1.2$ Hz, 1H), 7.04 (dq, $J = 8.7, 1.2$ Hz, 2H), 7.01 (dt, $J = 8.7,$
15 2.1 Hz, 2H), 5.82 (brs, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.07-3.85 (m, 3H), 3.55-3.46 (m, 2H),
3.19-2.97 (m, 4H), 2.02-1.49 (m, 11H), 1.48-1.12 (m, 6H), 1.08-0.90 (m, 2H),
0.90 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

実施例 67 (H32-1) ~ 67 (H34-15)

参考例 2 で製造した樹脂 (3)、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当す

るアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体、および相当するアルデヒド誘導体を用いて、実施例 2 3 と同様の操作をし、以下の表 3 2 A - 1 ~ 3 4 A - 2 に化合物名を示し、表 3 2 B - 1 ~ 3 4 B - 3 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 3 2 C - 1 ~ 3 4 C - 1 に示した。

表32A-1

実施例番号	化合物名
67 (H32-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-7)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-8)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-9)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表32A-2

実施例番号	化合物名
67 (H32-10)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-11)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-12)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-13)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-14)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-15)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-16)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-17)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-18)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表32A-3

実施例番号	化合物名
67 (H32-19)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシベンジル)-9-シクロヘキシリメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
67 (H32-20)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシベンジル)-9-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
67 (H32-21)	(3R) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシベンジル)-9-シクロヘキシリメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
67 (H32-22)	(3R) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシベンジル)-9-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
67 (H32-23)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
67 (H32-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表33A-1

実施例番号	化合物名
67 (H33-1)	1-(2-クロロフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-2)	1-(2-フルオロフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-3)	1-(2-トリフルオロメチルフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-4)	1-シクロプロピルメチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-5)	1-(2,2-ジメチルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-6)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-7)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-8)	1-((2E)-2-ブテニル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表33A-2

実施例番号	化合物名
67 (H33-9)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-10)	1-(2-フェニルオキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-11)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-12)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-13)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-14)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-15)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-16)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表33A-3

実施例番号	化合物名
67 (H33-17)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-18)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

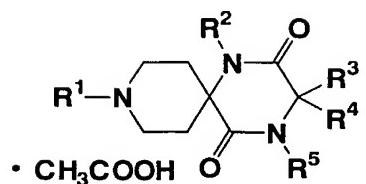
表34A-1

実施例番号	化合物名
67 (H34-1)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S) - 1-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-2)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S) - 1-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-3)	(3S) - 1 - (2-メトキシエチル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1S) - 1-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-4)	(3S) - 1 - (2-メトキシエチル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1S) - 1-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-5)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (シクロヘキシリメチルオキシメチル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-6)	(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (シクロヘキシリメチルオキシメチル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-7)	(3S) - 1 - (2-メトキシエチル) - 2, 5-ジオキソ-3- (シクロヘキシリメチルオキシメチル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表34A-2

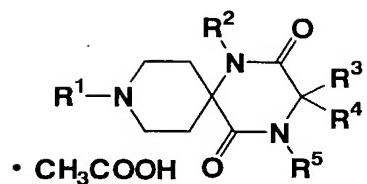
実施例番号	化合物名
67 (H34-8)	(3S) - 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシリメチルオキシメチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-9)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-10)	1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-11)	1 - (3 - メチル - 2 - プテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-12)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((2E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-13)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - ((2E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-14)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - (キノリン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-15)	1 - (3 - メチル - 2 - プテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 32B-1



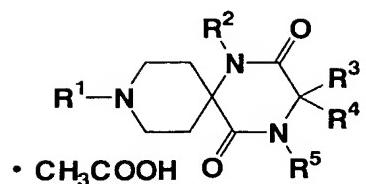
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H32-1)			H		H
67(H32-2)			H		H
67(H32-3)			H		H
67(H32-4)			H		H
67(H32-5)			H		H
67(H32-6)			H		H

表 32B-2



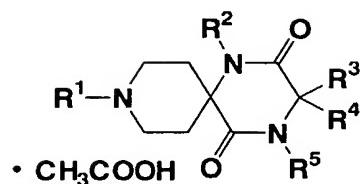
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H32-7)			H		H
67(H32-8)			H		H
67(H32-9)			H		H
67(H32-10)			H		H
67(H32-11)			H		H
67(H32-12)			H		H

表 32B-3



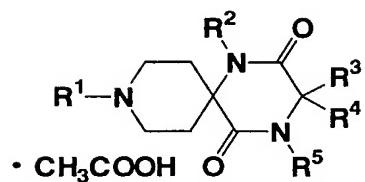
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H32-13)			H		H
67(H32-14)			H		H
67(H32-15)			H		H
67(H32-16)			H		H
67(H32-17)			H		H
67(H32-18)			H		H
67(H32-19)			H		H

表 32B-4



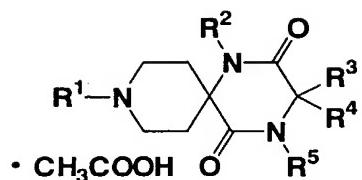
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H32-20)			H		H
67(H32-21)			H		H
67(H32-22)			H		H
67(H32-23)			H		H
67(H32-24)			H		H

表 33B-1



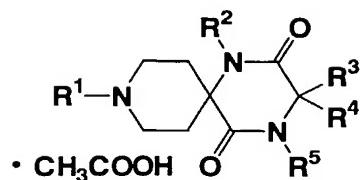
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H33-1)			H		H
67(H33-2)			H		H
67(H33-3)			H		H
67(H33-4)			H		H
67(H33-5)			H		H
67(H33-6)			H		H

表 33B-2



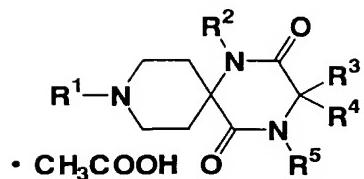
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H33-7)			H		H
67(H33-8)			H		H
67(H33-9)			H		H
67(H33-10)			H		H
67(H33-11)			H		H
67(H33-12)			H		H
67(H33-13)			H		H

表 33B-3



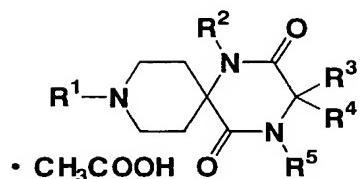
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H33-14)			H		H
67(H33-15)			H		H
67(H33-16)			H		H
67(H33-17)			H		H
67(H33-18)			H		H

表 34B-1



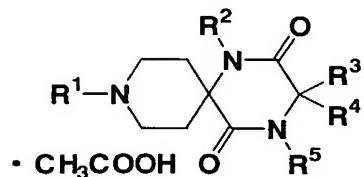
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H34-1)			H		H
67(H34-2)			H		H
67(H34-3)			H		H
67(H34-4)			H		H
67(H34-5)			H		H

表 34B-2



実施例番号	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5
67(H34-6)			H		H
67(H34-7)			H		H
67(H34-8)			H		H
67(H34-9)			H		H
67(H34-10)			H		H
67(H34-11)			H		H

表 34B-3



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H34-12)			H		H
67(H34-13)			H		H
67(H34-14)			H		H
67(H34-15)			H		H

表32C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H32-1)	F	3.42	450 (M + H) ⁺ , 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-2)	F	3.40	478 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-3)	F	3.72	512 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-4)	F	3.71	526 (M + H) ⁺ , 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-5)	F	3.42	514 (M + H) ⁺ , 303, 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-6)	F	3.31	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-7)	F	3.27	452 (M + H) ⁺ , 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-8)	F	3.27	480 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-9)	F	3.55	514 (M + H) ⁺ , 339, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-10)	F	3.58	528 (M + H) ⁺ , 339, 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-11)	F	3.29	516 (M + H) ⁺ , 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-12)	F	3.12	488 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-13)	F	3.47	484 (M + H) ⁺ , 303, 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-14)	F	3.47	512 (M + H) ⁺ , 303, 148.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-15)	F	3.73	546 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-16)	F	3.75	560 (M + H) ⁺ , 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-17)	F	3.49	548 (M + H) ⁺ , 303, 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-18)	F	3.33	520 (M + H) ⁺ , 404.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-19)	F	3.52	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-20)	F	3.29	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-21)	F	3.49	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-22)	F	3.31	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-23)	F	3.78	502 (M + H) ⁺ , 206.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-24)	F	3.69	498 (M + H) ⁺ , 279, 203.	ESI (Pos., 40 V)

表33C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H33-1)	F	3.78	546 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-2)	F	3.75	530 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-3)	F	3.84	580 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-4)	F	3.66	476 (M + H) ⁺ , 339, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-5)	F	3.80	492 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-6)	F	3.73	518 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-7)	F	3.67	502 (M + H) ⁺ , 182.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-8)	F	3.67	476 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-9)	F	3.36	422 (M + H) ⁺ , 298, 125.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-10)	F	3.80	542 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-11)	F	3.44	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-12)	F	3.44	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-13)	F	3.38	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-14)	F	3.36	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-15)	F	3.26	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-16)	F	3.22	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-17)	F	3.20	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-18)	F	3.15	402 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表34C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H34-1)	F	3.71	478 (M + H) ⁺ , 279, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-2)	F	3.42	444 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-3)	F	3.55	480 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-4)	F	3.23	446 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-5)	F	3.9	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-6)	F	3.65	514 (M + H) ⁺ , 279, 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-7)	F	3.76	550 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-8)	F	3.49	516 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-9)	F	3.47	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-10)	F	3.31	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-11)	F	3.73	490 (M + H) ⁺ , 279, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-12)	F	3.55	412 (M + H) ⁺ , 117.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-13)	F	3.72	452 (M + H) ⁺ , 379, 279, 117.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-14)	F	3.44	477 (M + H) ⁺ , 404, 345.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-15)	F	3.64	496 (M + H) ⁺ , 279, 149.	ESI (Pos., 40 V)

実施例 6 8 (H 3 5 - 1) ~ 6 8 (H 3 5 - 6 1)

参考例 2 で製造した樹脂 (3)、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当するアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体を用いて、参考例 1 1 と同様の操作をし、相当するアルコール誘導体を用いて、参考例 1 2 → 実施例 3 3 と同様の操作をし、樹脂から本発明化合物を切り出し、以下の表 3 5 A - 1 ~ 3 5 A - 8 に化合物名を示し、表 3 5 B - 1 ~ 3 5 B - 1 3 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 3 5 C - 1 ~ 3 5 C - 3 に示した。

表35A-1

実施例番号	化合物名
68 (H35-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-2)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-4)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-6)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(2-(N, N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表35A-2

実施例番号	化合物名
68 (H35-8)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-9)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-10)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-11)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-12)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-13)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-14)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-15)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-3

実施例番号	化合物名
68 (H35-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-17)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-19)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-20)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-21)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-22)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-23)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表35A-4

実施例番号	化合物名
68 (H35-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-25)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-27)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-29)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-30)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表35A-5

実施例番号	化合物名
68 (H35-32)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-33)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-34)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-35)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-36)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-37)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-38)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-6

実施例番号	化合物名
68 (H35-39)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-40)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-41)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-42)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-43)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-44)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-45)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

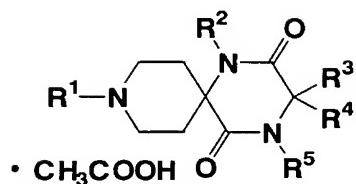
表35A-7

実施例番号	化合物名
68 (H35-46)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-シクロプロチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-47)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-シクロプロチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-48)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-シクロプロチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-49)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-50)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-51)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-52)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-53)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-8

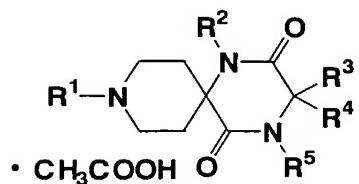
実施例番号	化合物名
68 (H35-54)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-55)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-56)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-57)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-58)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-59)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-60)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロブチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-61)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 35B-1



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-1)			H		H
68(H35-2)			H		H
68(H35-3)			H		H
68(H35-4)			H		H

表 35B-2



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-5)			H		H
68(H35-6)			H		H
68(H35-7)			H		H
68(H35-8)			H		H
68(H35-9)			H		H

表 35B-3



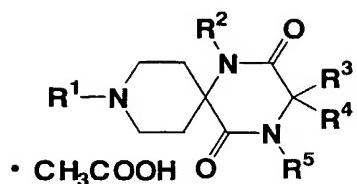
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-10)			H		H
68(H35-11)			H		H
68(H35-12)			H		H
68(H35-13)			H		H
68(H35-14)			H		H
68(H35-15)			H		H

表 35B-4



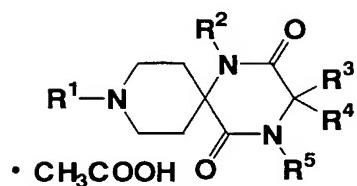
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-16)			H		H
68(H35-17)			H		H
68(H35-18)			H		H
68(H35-19)			H		H
68(H35-20)			H		H

表 35B-5



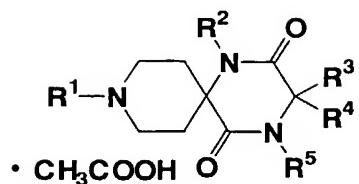
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-21)			H		H
68(H35-22)			H		H
68(H35-23)			H		H
68(H35-24)			H		H
68(H35-25)			H		H

表 35B-6



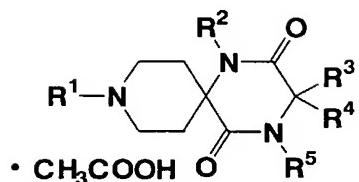
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-26)			H		H
68(H35-27)			H		H
68(H35-28)			H		H
68(H35-29)			H		H
68(H35-30)			H		H

表 35B-7



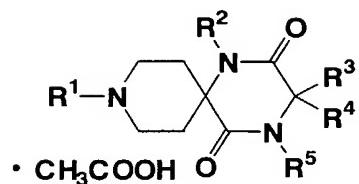
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-31)			H		H
68(H35-32)			H		H
68(H35-33)			H		H
68(H35-34)			H		H
68(H35-35)			H		H

表 35B-8



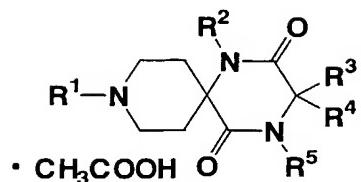
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-36)			H		H
68(H35-37)			H		H
68(H35-38)			H		H
68(H35-39)			H		H
68(H35-40)			H		H

表 35B-9



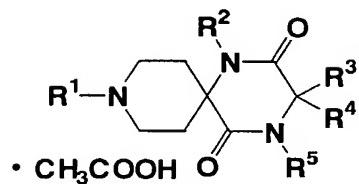
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-41)			H		H
68(H35-42)			H		H
68(H35-43)			H		H
68(H35-44)			H		H
68(H35-45)			H		H

表 35B-10



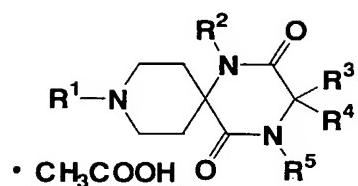
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-46)			H		H
68(H35-47)			H		H
68(H35-48)			H		H
68(H35-49)			H		H
68(H35-50)			H		H

表 35B-11



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-51)			H		H
68(H35-52)			H		H
68(H35-53)			H		H
68(H35-54)			H		H
68(H35-55)			H		H

表 35B-12



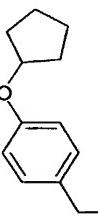
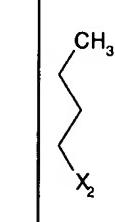
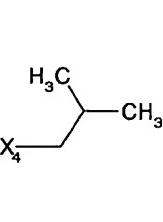
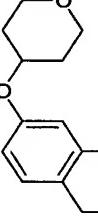
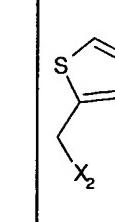
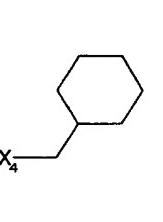
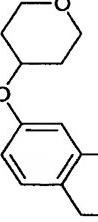
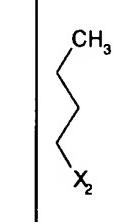
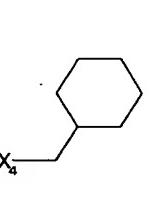
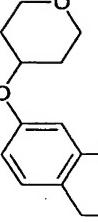
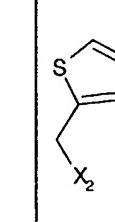
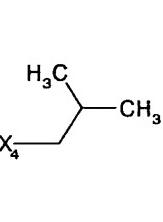
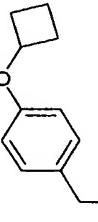
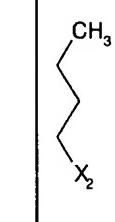
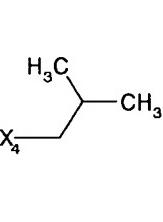
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-56)			H		H
68(H35-57)			H		H
68(H35-58)			H		H
68(H35-59)			H		H
68(H35-60)			H		H

表 35B-13



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-61)			H		H

表35C-1

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-1)	F	3.31	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-2)	F	3.24	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-3)	F	3.22	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-4)	F	3.11	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-5)	F	3.11	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-6)	F	3.09	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-7)	F	3.05	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-8)	F	3.57	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-9)	F	3.57	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-10)	F	3.51	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-11)	F	3.49	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-12)	F	3.40	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-13)	F	3.36	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-14)	F	3.29	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-15)	F	3.66	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-16)	F	3.64	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-17)	F	3.58	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-18)	F	3.59	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-19)	F	3.47	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-20)	F	3.45	463 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-21)	F	3.40	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-22)	F	3.38	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-23)	F	3.76	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-24)	F	3.74	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-25)	F	3.68	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-26)	F	3.66	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-27)	F	3.58	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-28)	F	3.57	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表35C-2

実施例番号	HPLC 条件	保持時間(分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-29)	F	3.51	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-30)	F	3.71	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-31)	F	3.70	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-32)	F	3.66	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-33)	F	3.64	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-34)	F	3.55	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-35)	F	3.52	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-36)	F	3.48	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-37)	F	3.45	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-38)	F	3.71	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-39)	F	3.72	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-40)	F	3.66	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-41)	F	3.64	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-42)	F	3.55	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-43)	F	3.53	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-44)	F	3.48	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-45)	F	3.47	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-46)	F	3.78	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-47)	F	3.77	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-48)	F	3.54	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-49)	F	3.81	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-50)	F	3.83	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-51)	F	3.74	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-52)	F	3.74	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-53)	F	3.64	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-54)	F	3.65	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-55)	F	3.57	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-56)	F	3.57	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表35C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-57)	F	3.53	600 ($M + H$) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-58)	F	3.59	560 ($M + H$) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-59)	F	3.42	560 ($M + H$) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-60)	F	3.66	456 ($M + H$) ⁺ , 279, 161.	ESI (Pos., 40 V)
68 (H35-61)	F	3.45	486 ($M + H$) ⁺ , 369, 191.	ESI (Pos., 40 V)

実施例 6 9 (H 3 6 - 1) ~ 6 9 (H 3 6 - 2 4)

実施例 1 4 で製造した化合物の代わりに、相当するアミン誘導体と相当する酸クロライド誘導体を用いて、実施例 2 2 と同様の操作をし、以下の表 3 6 A - 1 ~ 3 6 A - 4 に化合物名を示し、表 3 6 B - 1 ~ 3 6 B - 5 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 3 6 C - 1 に示した。

表36A-1

実施例番号	化合物名
69 (H36-1)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((2 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-2)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((3 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-3)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((4 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-4)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((2 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-5)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((3 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-6)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((4 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-7)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - (2 - フェニルフェニル) カルボニルアミノエチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表36A-2

実施例番号	化合物名
69 (H36-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(2-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(3-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(4-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(2-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

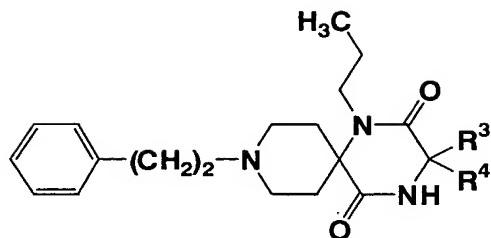
表36A-3

実施例番号	化合物名
69 (H36-15)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-16)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(2-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-17)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(3-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-18)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(4-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-19)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-20)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
69 (H36-21)	(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表36A-4

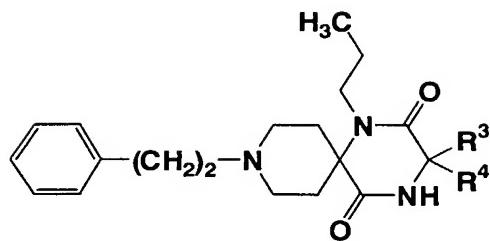
実施例番号	化合物名
69 (H36-22)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルフェニル)アセチルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-23)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(3-フェニルフェニル)アセチルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-24)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(4-フェニルフェニル)アセチルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 36B-1



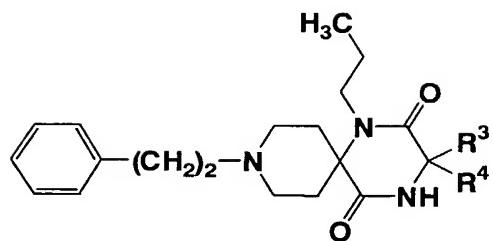
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-1)	H		H
69(H36-2)	H		H
69(H36-3)	H		H
69(H36-4)	H		H
69(H36-5)	H		H
69(H36-6)	H		H

表 36B-2



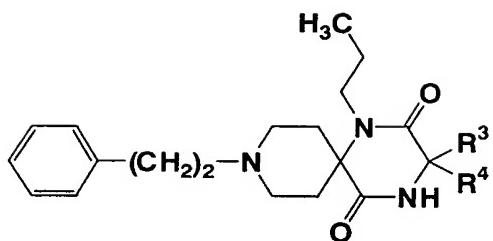
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-7)	H		H
69(H36-8)	H		H
69(H36-9)	H		H
69(H36-10)	H		H
69(H36-11)	H		H
69(H36-12)	H		H
69(H36-13)	H		H

表 36B-3



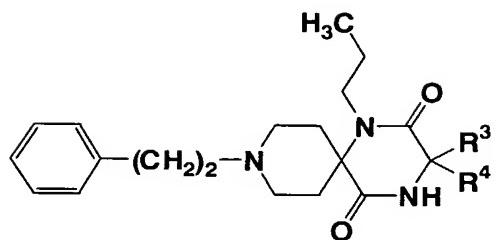
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-14)	H		H
69(H36-15)	H		H
69(H36-16)	H		H
69(H36-17)	H		H

表 36B-4



実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-18)	H		H
69(H36-19)	H		H
69(H36-20)	H		H
69(H36-21)	H		H
69(H36-22)	H		H

表 36B-5



実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-23)	H		H
69(H36-24)	H		H

表36C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
69 (H36-1)	F	3.38	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-2)	F	3.47	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-3)	F	3.47	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-4)	F	3.45	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-5)	F	3.44	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-6)	F	3.44	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-7)	F	3.40	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-8)	F	3.49	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-9)	F	3.49	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-10)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-11)	F	3.49	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-12)	F	3.49	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-13)	F	3.36	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-14)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-15)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-16)	F	3.45	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-17)	F	3.47	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-18)	F	3.47	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-19)	F	3.40	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-20)	F	3.49	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-21)	F	3.43	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-22)	F	3.47	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-23)	F	3.49	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-24)	F	3.49	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

[製剤例]

製剤例 1

以下の各成分を常法により混合した後打錠して、一錠中に 50 mg の活性成分を含有する錠剤 100錠を得た。

5	・ 9 - ((3, 5-ジメチル-1-フェニル) - 4-ピラゾリル) メチル - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1-プロピル - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩	-----5.0 g
	・カルボキシメチルセルロースカルシウム（崩壊剤）	-----0.2 g
10	・ステアリン酸マグネシウム（潤滑剤）	-----0.1 g
	・微結晶セルロース	-----4.7 g

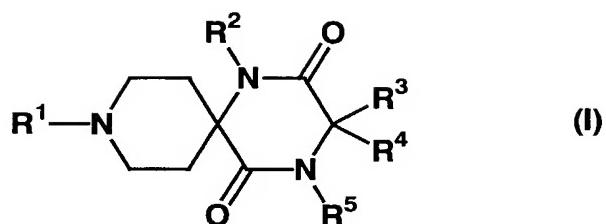
製剤例 2

以下の各成分を常法により混合した後、溶液を常法により滅菌し、5 ml ずつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、1アンプル中 20 mg の活性成分を含有するアンプル 100 本を得た。

15	・ 9 - ((3, 5-ジメチル-1-フェニル) - 4-ピラゾリル) メチル - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1-プロピル - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩	-----2.0 g
20	・マンニトール	-----20 g
	・蒸留水	-----500ml

請求の範囲

1. 一般式 (I)



- 5 [式中、R¹は、
 (1) 水素原子、
 (2) C₁～18アルキル基、
 (3) C₂～18アルケニル基、
 (4) C₂～18アルキニル基、
 10 (5) -COR⁶、
 (6) -CONR⁷R⁸、
 (7) -COOR⁹、
 (8) -SO₂R¹⁰、
 (9) -OCOCOOR¹¹、
 15 (10) -CONR¹²COR¹³、
 (11) Cyclo、または
 (12) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)-CONR⁷R⁸、
 (c)-COOR⁹、(d)-OR¹⁴、(e)-SR¹⁵、(f)-NR¹⁶R¹⁷、(g)-NR¹⁸COR¹⁹、
 20 (h)-SO₂NR²⁰R²¹、(i)-OCOR²²、(j)-NR²³SO₂R²⁴、(k)-NR²⁵COOR²⁶、(l)-NR²⁷CONR²⁸R²⁹、(m) Cyclo、
 (n)ケト基、(o)-N(SO₂R²⁴)₂によって置換されたC₁～18アルキル基、C₂～18アルケニル基、またはC₂～18アルキニル基を表わし、
 (基中、R⁶～R⁹、R¹¹～R²¹、R²³、R²⁵およびR²⁷～R²⁹はそれぞれ

独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) C₁～8アルキル基、
- (3) C₂～8アルケニル基、
- 5 (4) C₂～8アルキニル基、
- (5) C_{y c 1}、または

(6) 任意に選ばれた1～5個の(a)C_{y c 1}、(b)ハロゲン原子、(c)-OR^{3 0}、
 (d)-SR^{3 1}、(e)-NR^{3 2}R^{3 3}、(f)-COOR^{3 4}、(g)-CONR^{3 5}R^{3 6}、
 (h)-NR^{3 7}COR^{3 8}、(i)-NR^{3 9}SO₂R^{4 0}、(j)-N(SO₂R^{4 0})₂によ

10 って置換されたC₁～8アルキル基、C₂～8アルケニル基、またはC₂～8アルキニル基を表わすか、

R⁷とR⁸、R^{2 0}とR^{2 1}、R^{2 8}とR^{2 9}は一緒になって、1) C₂～6アルキレン基、2)- (C₂～6アルキレン基) -O- (C₂～6アルキレン基) -、
 3)- (C₂～6アルキレン基) -S- (C₂～6アルキレン基) -、または
 15 4)- (C₂～6アルキレン基) -NR^{1 9}5- (C₂～6アルキレン基) -を表
 わし(基中、R^{1 9}5は、水素原子、C₁～8アルキル基、フェニル基、または
 フェニル基によって置換されたC₁～8アルキル基を表わす。)、

R^{1 0}、R^{2 2}、R^{2 4}およびR^{2 6}はそれぞれ独立して、

- (1) C₁～8アルキル基、
- (2) C₂～8アルケニル基、
- (3) C₂～8アルキニル基、
- 20 (4) C_{y c 1}、または

(5) 任意に選ばれた1～5個の(a)C_{y c 1}、(b)ハロゲン原子、(c)-OR^{3 0}、
 (d)-SR^{3 1}、(e)-NR^{3 2}R^{3 3}、(f)-COOR^{3 4}、(g)-CONR^{3 5}R^{3 6}、
 25 (h)-NR^{3 7}COR^{3 8}、(i)-NR^{3 9}SO₂R^{4 0}、(j)-N(SO₂R^{4 0})₂によ
 って置換されたC₁～8アルキル基、C₂～8アルケニル基、またはC₂～

8 アルキニル基を表わし、

(基中、 $R^{30} \sim R^{37}$ および R^{39} はそれぞれ独立して、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、Cyc 1、または Cyc 1 によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基を表わすか、

5 R^{35} と R^{36} は一緒になって、1) C 2 ~ 6 アルキレン基、2) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - O - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - 、3) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - S - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - 、または 4) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - NR¹⁹⁶ - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - を表わし (基中、 R^{196} は、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換
10 された C 1 ~ 8 アルキル基を表わす。) 、

R^{38} および R^{40} はそれぞれ独立して、C 1 ~ 8 アルキル基、Cyc 1、または Cyc 1 によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基を表わす。)

Cyc 1 は、C 3 ~ 15 の単環、二環、または三環式 (縮合またはスピロ) 炭素環、または 1 ~ 4 個の窒素原子、1 ~ 3 個の酸素原子および/または 1
15 ~ 3 個の硫黄原子を含む 3 ~ 15 頁の単環、二環、または三環式 (縮合またはスピロ) 複素環を表わす。

ただし、Cyc 1 は 1 ~ 5 個の R^{51} によって置換されていてもよく、

R^{51} は、

- (1) C 1 ~ 8 アルキル基、
- 20 (2) C 2 ~ 8 アルケニル基、
- (3) C 2 ~ 8 アルキニル基、
- (4) ハロゲン原子、
- (5) ニトロ基、
- (6) トリフルオロメチル基、
- 25 (7) トリフルオロメトキシ基、
- (8) ニトリル基、

- (9) ケト基、
- (10) C y c 2
- (11) -OR^{5 2}、
- (12) -SR^{5 3}、
- 5 (13) -NR^{5 4}R^{5 5}、
- (14) -COOR^{5 6}、
- (15) -CONR^{5 7}R^{5 8}、
- (16) -NR^{5 9}COR^{6 0}、
- (17) -SO₂NR^{6 1}R^{6 2}、
- 10 (18) -OCOR^{6 3}、
- (19) -NR^{6 4}SO₂R^{6 5}、
- (20) -NR^{6 6}COOR^{6 7}、
- (21) -NR^{6 8}CONR^{6 9}R^{7 0}、
- (22) -B (OR^{7 1})₂、
- 15 (23) -SO₂R^{7 2}、
- (24) -N (SO₂R^{7 2})₂、 または
- (25) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)C y c 2、(c)-OR⁵
2、(d)-SR^{5 3}、(e)-NR^{5 4}R^{5 5}、(f)-COOR^{5 6}、(g)-CONR^{5 7}R
5 8、(h)-NR^{5 9}COR^{6 0}、(i)-SO₂NR^{6 1}R^{6 2}、(j)-OCOR^{6 3}、(k)
20 -NR^{6 4}SO₂R^{6 5}、(l)-NR^{6 6}COOR^{6 7}、(m)-NR^{6 8}CONR^{6 9}R⁷
0、(n)-B (OR^{7 1})₂、(o)-SO₂R^{7 2}、(p)-N (SO₂R^{7 2})₂によつ
て置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキ
ニル基を表わす。)
- (基中、R^{5 2}～R^{6 2}、R^{6 4}、R^{6 6}およびR^{6 8}～R^{7 1}はそれぞれ独立して、
- 25 1)水素原子、2)C 1～8アルキル基、3)C 2～8アルケニル基、4)C 2～8
アルキニル基、5)C y c 2、または6)C y c 2、-OR^{7 3}、-COOR^{7 4}、

—N R⁷⁵ R⁷⁶によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、

R⁵⁷とR⁵⁸、R⁶¹とR⁶²、R⁶⁹とR⁷⁰は一緒になって、1) C 2～6アルキ

レン基、2) —(C 2～6アルキレン基) —O—(C 2～6アルキレン基) —、

5 3) —(C 2～6アルキレン基) —S—(C 2～6アルキレン基) —、または
4) —(C 2～6アルキレン基) —NR¹⁹⁷—(C 2～6アルキレン基) —を表
わし(基中、R¹⁹⁷は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、または
フェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)、

R⁶³、R⁶⁵、R⁶⁷およびR⁷²はそれぞれ独立して、1) C 1～8アルキル基、

10 2) C 2～8アルケニル基、3) C 2～8アルキニル基、4) Cyc 2、または5)
Cyc 2、—OR⁷³、—COOR⁷⁴、—NR⁷⁵ R⁷⁶によって置換されたC 1
～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わし、

(基中、R⁷³～R⁷⁶はそれぞれ独立して、水素原子、C 1～8アルキル基、

Cyc 2、またはCyc 2によって置換されたC 1～8アルキル基を表わ

15 す。)

Cyc 2はCyc 1と同じ意味を表わす。

ただし、Cyc 2は1～5個のR⁷⁷によって置換されていてもよく、

R⁷⁷は、

1) C 1～8アルキル基、

20 2) ハロゲン原子、

3) ニトロ基、

4) トリフルオロメチル基、

5) トリフルオロメトキシ基、

6) ニトリル基、

25 7) —OR⁷⁸、

8) —NR⁷⁹ R⁸⁰、

- 9) $-COOR^{8\ 1}$ 、
 10) $-SR^{8\ 2}$ 、
 11) $-CONR^{8\ 3}R^{8\ 4}$ 、
 12) C 2～8 アルケニル基、
 5 13) C 2～8 アルキニル基、
 14) ケト基、
 15) Cyc 6、
 16) $-NR^{1\ 6\ 1}COR^{1\ 6\ 2}$ 、
 17) $-SO_2NR^{1\ 6\ 3}R^{1\ 6\ 4}$ 、
 10 18) $-OCOR^{1\ 6\ 5}$ 、
 19) $-NR^{1\ 6\ 6}SO_2R^{1\ 6\ 7}$ 、
 20) $-NR^{1\ 6\ 8}COOR^{1\ 6\ 9}$ 、
 21) $-NR^{1\ 7\ 0}CONR^{1\ 7\ 1}R^{1\ 7\ 2}$ 、
 22) $-SO_2R^{1\ 7\ 3}$ 、
 15 23) $-N(SO_2R^{1\ 6\ 7})_2$ 、
 24) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) $-OR^{7\ 8}$ 、(c) $-NR^{7\ 9}$
 $R^{8\ 0}$ 、(d) $-COOR^{8\ 1}$ 、(e) $-SR^{8\ 2}$ 、(f) $-CONR^{8\ 3}R^{8\ 4}$ 、(g) ケト基、
 (h) Cyc 6、(i) $-NR^{1\ 6\ 1}COR^{1\ 6\ 2}$ 、(j) $-SO_2NR^{1\ 6\ 3}R^{1\ 6\ 4}$ 、(k) $-OCOR^{1\ 6\ 5}$ 、(l) $-NR^{1\ 6\ 6}SO_2R^{1\ 6\ 7}$ 、(m) $-NR^{1\ 6\ 8}COOR^{1\ 6\ 9}$ 、(n) $-NR^{1\ 7\ 0}CONR^{1\ 7\ 1}R^{1\ 7\ 2}$ 、(o) $-SO_2R^{1\ 7\ 3}$ 、(p) $-N(SO_2R^{1\ 6\ 7})_2$ によって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わす。)
 (基中、 $R^{7\ 8} \sim R^{8\ 4}$ 、 $R^{1\ 6\ 1} \sim R^{1\ 6\ 4}$ 、 $R^{1\ 6\ 6}$ 、 $R^{1\ 6\ 8}$ および $R^{1\ 7\ 0} \sim R^{1\ 7\ 2}$ はそれぞれ独立して、(a) 水素原子、(b) C 1～8 アルキル基、(c) C 2～8 アルケニル基、(d) C 2～8 アルキニル基、(e) Cyc 6、(f) Cyc 6、 $-OR^{1\ 7\ 4}$ 、 $-COOR^{1\ 7\ 5}$ 、 $-NR^{1\ 7\ 6}R^{1\ 7\ 7}$ 、 $-CONR^{1\ 7\ 8}R^{1\ 7\ 9}$ によって置換

されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、

R⁸³とR⁸⁴、R¹⁶³とR¹⁶⁴、R¹⁷¹とR¹⁷²は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) - (C 2～6アルキレン基) - O - (C 2～6アルキレン基)

5 3) - (C 2～6アルキレン基) - S - (C 2～6アルキレン基) - 、または4) - (C 2～6アルキレン基) - NR¹⁹⁸ - (C 2～6アルキレン基) - を表わし（基中、R¹⁹⁸は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。）、

R¹⁶⁵、R¹⁶⁷、R¹⁶⁹およびR¹⁷³はそれぞれ独立して、(a) C 1～8アルキ

10 ル基、(b) C 2～8アルケニル基、(c) C 2～8アルキニル基、(d) Cyc 6、または(e) Cyc 6、- OR¹⁷⁴、- COOR¹⁷⁵、- NR¹⁷⁶R¹⁷⁷、- CO

NR¹⁷⁸R¹⁷⁹によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わす。）

(基中、R¹⁷⁴～R¹⁷⁷はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1～8アルキ

15 ル基、3) Cyc 6、または4) Cyc 6によって置換されたC 1～8アルキル基を表わすか、

R¹⁷⁸とR¹⁷⁹は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) - (C 2～6アルキレン基) - O - (C 2～6アルキレン基) - 、3) - (C 2～6アルキ

20 レン基) - S - (C 2～6アルキレン基) - 、または4) - (C 2～6アルキレン基) - NR¹⁹⁹ - (C 2～6アルキレン基) - を表わし（基中、R¹⁹⁹は、

水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。）、

Cyc 6は、C 3～8の単環式炭素環または1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含む3～8員の単環式複素

25 環を表わす。

ただし、Cyc 6は1～5個のR¹⁸⁰によって置換されていてもよく、

R^{180} は、

- (1) C 1～8 アルキル基、
- (2) ハロゲン原子、
- (3) ニトロ基、
- 5 (4) トリフルオロメチル基、
- (5) トリフルオロメトキシ基、
- (6) ニトリル基、
- (7) $-OR^{181}$ 、
- (8) $-NR^{182}R^{183}$ 、
- 10 (9) $-COOR^{184}$ 、
- (10) $-SR^{185}$ 、または
- (11) $-CONR^{186}R^{187}$ を表わし
(基中、 $R^{181} \sim R^{187}$ はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1～8 アルキル基、3) フェニル基、または4) フェニル基によって置換された C 1～8 アルキル基を表わすか、
- 15 R^{182} と R^{183} 、 R^{186} と R^{187} は一緒になって、1) C 2～6 アルキレン基、
2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{200}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わす(基中、 R^{200} は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、フェニル基によって置換された C 1～8 アルキル基を表わす。)。)
- 20 R^2 は、
 - (1) 水素原子、
 - (2) C 1～8 アルキル基、
 - (3) C 2～8 アルケニル基、
 - (4) C 2～8 アルキニル基、

- (5) $-OR^{90}$ 、
- (6) Cyc 3、または
- (7) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b) $-OR^{90}$ 、(c) $-SR^{91}$ 、(d) $-NR^{92}R^{93}$ 、(e) $-COOR^{94}$ 、(f) $-CONR^{95}R^{96}$ 、(g) $-N_5R^{97}COR^{98}$ 、(h) $-SO_2NR^{99}R^{100}$ 、(i) $-OCOR^{101}$ 、(j) $-NR^{102}SO_2R^{103}$ 、(k) $-NR^{104}COOR^{105}$ 、(l) $-NR^{106}CONR^{107}R^{108}$ 、
 5 (m) Cyc 3、(n)ケト基、(o) $-N(SO_2R^{103})_2$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基またはC 2～8アルキニル基を表わし、
- 10 (基中、 $R^{90} \sim R^{100}$ 、 R^{102} 、 R^{104} および $R^{106} \sim R^{108}$ はそれぞれ独立して、1)水素原子、2)C 1～8アルキル基、3)C 2～8アルケニル基、4)C 2～8アルキニル基、5)Cyc 3、または6)Cyc 3によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、
- 15 R^{95} と R^{96} 、 R^{99} と R^{100} 、 R^{107} と R^{108} は一緒になって、1)C 2～6アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-$ 、または4) $-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-NR^{201}-(C 2 \sim 6\text{アルキレン基})-$ を表わし（基中、 R^{201} は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。）、
 20 R^{101} 、 R^{103} および R^{105} はそれぞれ独立して、1)C 1～8アルキル基、2)C 2～8アルケニル基、3)C 2～8アルキニル基、または4)Cyc 3またはCyc 3によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わし、
- 25 Cyc 3はCyc 1と同じ意味を表わす。
 ただし、Cyc 3は1～5個の R^{109} によって置換されていてもよく、

R^{109} は R^{51} と同じ意味を表わす。)

R^3 および R^4 はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) C 1～8 アルキル基、

5 (3) C 2～8 アルケニル基、

(4) C 2～8 アルキニル基、

(5) $-COOR^{120}$ 、

(6) $-CONR^{121}R^{122}$ 、

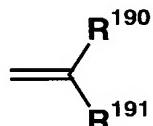
(7) Cyc 4、または

10 (8) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c) Cyc 4、(d) $-COOR^{120}$ 、(e) $-CONR^{121}R^{122}$ 、(f) $-OR^{123}$ 、(g) $-SR^{124}$ 、(h) $-NR^{125}R^{126}$ 、(i) $-NR^{127}COR^{128}$ 、(j) $-SO_2NR^{129}R^{130}$ 、(k) $-OCOR^{131}$ 、(l) $-NR^{132}SO_2R^{133}$ 、(m) $-NR^{134}COOR^{135}$ 、(n) $-NR^{136}CONR^{137}R^{138}$ 、(o) $-S-SR^{139}$ 、(p) $-NH-C(=N)-NHR^{140}$ 、(q) ケト基、(r) $-NR^{145}CONR^{146}COR^{147}$ 、(s) $-N(SO_2R^{133})_2$ によって置換されたC 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、またはC 2～8 アルキニル基を表わし、

15 (基中、 $R^{120} \sim R^{130}$ 、 R^{132} 、 R^{134} 、 $R^{136} \sim R^{138}$ 、 R^{145} および R^{146} はそれぞれ独立して、1)水素原子、2)C 1～8 アルキル基、3)C 2～8 アルケニル基、4)C 2～8 アルキニル基、5)Cyc 4、または6)Cyc 4、ハロゲン原子、 $-OR^{148}$ 、 $-SR^{149}$ 、 $-COOR^{150}$ 、または $-NHCOR^{141}$ によって置換されたC 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わすか、

20 R^{121} と R^{122} 、 R^{129} と R^{130} 、 R^{137} と R^{138} は一緒になって、1)C 2～6 アルキレン基、2) $- (C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基}) - O - (C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基}) -$ 、3) $- (C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基}) - S - (C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基}) -$ 、

または 4) - (C 2～6 アルキレン基) - N R²⁰² - (C 2～6 アルキレン基) - を表わし (基中、R²⁰²は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、フェニル基によって置換されたC 1～8 アルキル基を表わす。) 、
 R¹³¹、R¹³³、R¹³⁵、R¹³⁹およびR¹⁴⁷はそれぞれ独立して、1) C 1～8
 5 アルキル基、2) C 2～8 アルケニル基、3) C 2～8 アルキニル基、4) C y c
 4、または5) C y c 4、ハロゲン原子、-OR¹⁴⁸、-SR¹⁴⁹、-COOR
 150、または-NHCOR¹⁴¹によって置換されたC 1～8 アルキル基、C 2
 ～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わし、
 R¹⁴⁰は、水素原子、-COOR¹⁴²、または-SO₂R¹⁴³を表わし、
 10 (基中、R¹⁴¹～R¹⁴³はそれぞれ独立して、1) C 1～8 アルキル基、2) C 2
 ～8 アルケニル基、3) C 2～8 アルキニル基、4) C y c 4、または5) C y c
 4によって置換されたC 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～
 8 アルキニル基を表わし、
 R¹⁴⁸～R¹⁵⁰はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1～8 アルキル基、3)
 15 C 2～8 アルケニル基、4) C 2～8 アルキニル基、5) C y c 4、または6) C
 y c 4によって置換されたC 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C
 2～8 アルキニル基を表わし、
 C y c 4はC y c 1と同じ意味を表わす。
 ただし、C y c 4は1～5個のR¹⁴⁴によって置換されていてもよく、
 20 R¹⁴⁴はR⁵¹と同じ意味を表わす。) を表わすか
 R³とR⁴は一緒になって、



(基中、R¹⁹⁰およびR¹⁹¹はそれぞれ独立して、R³またはR⁴と同じ意味を表わす。) を表わし、

R^5 は、

- (1) 水素原子、
- (2) C₁～8アルキル基、
- (3) Cyc₅、または

5 (4) Cyc₅によって置換されたC₁～8アルキル基を表わす。

(基中、Cyc₅はCyc₁と同じ意味を表わす。)

ただし、Cyc₅は1～5個の R^{160} によって置換されていてもよく、

R^{160} は R^{51} と同じ意味を表わす。)]

で示されるトリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体、それらの四級アン

10 モニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩。

2. 請求の範囲1に記載の一般式(I)中、 R^3 および R^4 が水素原子である請求の範囲1記載の化合物。

15 3. 請求の範囲1に記載の一般式(I)中、 R^3 が水素原子、

R^4 が

- (1) C₁～8アルキル基、
- (2) C₂～8アルケニル基、
- (3) C₂～8アルキニル基、
- (4) -COOR¹²⁰、
- (5) -CONR¹²¹R¹²²、
- (6) Cyc₄、または

(7) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c) Cyc

c₄、(d)-COOR¹²⁰、(e)-CONR¹²¹R¹²²、(f)-OR¹²³、(g)-

25 SR¹²⁴、(h)-NR¹²⁵R¹²⁶、(i)-NR¹²⁷COR¹²⁸、(j)-SO₂NR¹
29 R¹³⁰、(k)-OCOR¹³¹、(l)-NR¹³²SO₂R¹³³、(m)-NR¹³⁴C

OOR^{135} 、(n) $-\text{NR}^{136}\text{CONR}^{137}\text{R}^{138}$ 、(o) $-\text{S}-\text{SR}^{139}$ 、(p) $-\text{NHC}(\text{=NH})\text{NHR}^{140}$ 、(q) ケト基、(r) $-\text{NR}^{145}\text{CONR}^{146}\text{COR}^{147}$ 、(s) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{133})_2$

(すべての記号は請求の範囲1記載と同じ意味を表わす。) によって置換されたC1～8アルキル基、C2～8アルケニル基、またはC2～8アルキニル基である請求の範囲1記載の化合物。

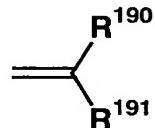
4. 請求の範囲1記載の一般式(I)中、 R^3 および R^4 がそれぞれ独立して、

- 10 (1) C1～8アルキル基、
- (2) C2～8アルケニル基、
- (3) C2～8アルキニル基、
- (4) $-\text{COOR}^{120}$ 、
- (5) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、
- 15 (6) Cyc4、または

(7) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c) Cyc4、(d) $-\text{COOR}^{120}$ 、(e) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、(f) $-\text{OR}^{123}$ 、(g) $-\text{SR}^{124}$ 、(h) $-\text{NR}^{125}\text{R}^{126}$ 、(i) $-\text{NR}^{127}\text{COR}^{128}$ 、(j) $-\text{SO}_2\text{NR}^{129}\text{R}^{130}$ 、(k) $-\text{OCOR}^{131}$ 、(l) $-\text{NR}^{132}\text{SO}_2\text{R}^{133}$ 、(m) $-\text{NR}^{134}\text{COOR}^{135}$ 、(n) $-\text{NR}^{136}\text{CONR}^{137}\text{R}^{138}$ 、(o) $-\text{S}-\text{SR}^{139}$ 、(p) $-\text{NHC}(\text{=NH})\text{NHR}^{140}$ 、(q) ケト基、(r) $-\text{NR}^{145}\text{CONR}^{146}\text{COR}^{147}$ 、(s) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{133})_2$

(すべての記号は請求の範囲1記載と同じ意味を表わす。) によって置換されたC1～8アルキル基、C2～8アルケニル基、またはC2～8アルキニル基である請求の範囲1記載の化合物。

5. 請求の範囲 1 記載の一般式 (I) 中、R³とR⁴が一緒になって、



(基中、すべての記号は請求の範囲 1 記載と同じ意味を表わす。) である請求の範囲 1 記載の化合物。

5

6. 化合物が

(1) 9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1-プロピル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

10 (2) 9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1-ブチル-3-シクロヘキシルメチル-2, 5-ジオキソ-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(3) 1-ブチル-3-シクロヘキシルメチル-2, 5-ジオキソ-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(4) 1-ブチル-3-(2-メチル-1-プロピル)-2, 5-ジオキソ-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

15 (5) (3S)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1-プロピル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(6) (3R)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1-プロピル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

- (7) 1-ブチル-9-((3, 5-ジメチル-1-フェニル)-4-ピラゾリル)メチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(8) 1-ブチル-3-シクロヘキシリメチル-2, 5-ジオキソ-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(9) 9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1-ブチル-3-(2-メチル-1-プロピル)-2, 5-ジオキソ-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
10 (10) 9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(11) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシリル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
15 (12) (3S)-1-(2-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(13) (3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
20 (14) (3R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(15) (3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(3-フェニルプロピル)-

- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(16) (3 R) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (17) (3 S) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(18) (3 R) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,
10 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(19) (3 S) -1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(20) (3 R) -1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (21) (3 S) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-(2-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル)エチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(22) (3 S) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-(2-クロロフェニルメチル)オキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (23) (3 S) -1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-[3-(3-(2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル)グアニジノ)プロピル]-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(24) 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.

5] ウンデカン、

(25) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

5 (26) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

10 (27) (3S)-1-プロピル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(28) (3R)-1-プロピル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

15 (29) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(30) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

20 (31) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(32) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

25 (33) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-プロピル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカ

ン、

(34) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-メトキシメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

5 (35) 1-(1-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(36) 1-(2-メチルブチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

10 (37) 1-(2-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(38) 1-(2-ジメチルアミノエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(39) 1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

20 (40) 1-(2-メチルチオエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(41) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

25 (42) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-

- (4–ベンジルオキシフェニルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(43) 1–ベンジル– 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (3, 5–ジメチル– 1–フェニルピラゾール– 4–イルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(44) 1 – (3–メチルフェニルメチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (1, 4–ベンゾジオキサン– 6–イルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(45) 1 – (3–メチルフェニルメチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (3, 5–ジメチル– 1–フェニルピラゾール– 4–イルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(46) 1 – (1–メチルブチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (4–フェニルオキシフェニルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(47) 1 – (3–メチルブチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (4–フェニルオキシフェニルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(48) 1 – (2–メトキシフェニルメチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – ((3, 5–ジメチル– 1–フェニル) – 4–ピラゾリル) メチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(49) 1 – (3–メトキシフェニルメチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – ((3, 5–ジメチル– 1–フェニル) – 4–ピラゾリル) メチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(50) 1 – (2–メチルフェニルメチル) – 2, 5–ジオキソ– 3 – (2–メチルプロピル) – 9 – (3, 5–ジメチル– 1–フェニルピラゾール– 4–イルメチル) – 1, 4, 9–トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (51) 1-(3-メチルフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (52) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (53) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 10 (54) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (55) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 15 (56) (3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-アリルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (57) (3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 20 (58) 1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (59) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 25 (60) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-1,4,

- 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(61) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(4-ジヒドロキシボランフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (62) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(1, 3-ベンゾジオキサン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(63) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル)エチル)-1, 4, 9-ト
10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(64) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-(4-フェニルオキシフェニル)エチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(65) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル)エチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (66) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-アリル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (67) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-アミノブチル)-9-フェニルエチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(68) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-(4-フェニル)フェニルカルボニル)アミノブチル)-9-フェニルエチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
25 (69) ヨウ化 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル

- 9 - メチル - 9 - (1 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イル) エチル)
 - 1, 4, - ジアザ - 9 - アゾニアスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (70) (3 S) - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチ
 ル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチル) -
 5 1 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5, 5] ウンデカン、
 (71) (3 S) - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチ
 ル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - オキソ - 2 - フェニルエチル) - 1 -
 プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5, 5] ウンデカン、
 (72) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メ
 チル - 9 - アリルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
 (73) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メ
 チル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
 15 (74) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4
 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニル
 エチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (75) (3 S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジ
 オキソ - 3 - メチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
 20 スピロ [5. 5] ウンデカン、
 (76) (3 S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジ
 オキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9
 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
 カン、
 25 (77) (3 S) - 1 - (2, 2 - ジフェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ
 - 3 - メチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン、

- (78) (3 S) - 1 - (2, 2-ジフェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (N-ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (79) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (80) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 4, 6 - トリメトキシベンジル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (81) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (82) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロパノイル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (83) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンゼンスルホニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (84) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンジルアミノカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (85) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (3 - フェニルプロパノイル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (86) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - ベンゼンス

ルホニルアミノブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(87) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N-ベン
ジルカルバモイル) アミノブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4,

5 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(88) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (4-メトキシフェ
ニルメチル) - 9-シクロヘキシルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、

(89) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 -
10 (2- (4-クロロフェニル) チオフェン-5-イルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(90) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 -
(2- (4-メトキシフェニル) チオフェン-5-イルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (91) 1- ((2 E) -ブテニル) - 2, 5-ジオキソ-3- (2-メチル
プロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
リ亞ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(92) 1- (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3- (2-メ
チルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(93) 1- (チオフェン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3- (2
-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

25 (94) 1-シクロプロピルメチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプ
ロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
リ亞ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (95) 1 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (96) 1 - (3 - メチル - 2 - プテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (97) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (キノリン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 10 (98) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシカルボニルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (99) 1 - (3 - メチル - 2 - プテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (100) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシリメチル - 9 - ((2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 15 (101) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (102) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 20 (103) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン、

(104) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

5 (105) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(106) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ

10 [5. 5] ウンデカン、

(107) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

15 (108) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(109) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

20 (110) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(111) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ

25 [5. 5] ウンデカン、

(112) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

ルー9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(113) 1-ペンチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(114) 1-(3-メトキシフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(115) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(116) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(117) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(118) 1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(シクロヘキシリメチルオキシメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(119) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(120) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (121) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルメチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (122) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-フェニルメチルチオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (123) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 10 (124) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (125) (3R)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 15 (126) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (127) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘプチルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 20 (128) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (129) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリ

- アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (130) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリプロピル)
 -9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (131) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシリプロピル)
 -9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (132) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-ヒドロキシ-2-メチル
 プロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-ト
 10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (133) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
 ル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)
 -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (134) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
 ル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)
 -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (135) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3,
 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 20 (136) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
 (2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 スピロ [5. 5] ウンデカン、
 (137) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2
 -フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
 25 ロ [5. 5] ウンデカン、
 (138) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4

－メチルベンゾモルホリン－7－イルメチル)－1, 4, 9－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(139) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－(2－メチルプロピル)－9－

(4－メチルベンゾモルホリン－7－イルメチル)－1, 4, 9－トリアザ

5 スピロ [5. 5] ウンデカン、

(140) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－(2－メチルプロピル)－9－

(4－(N－メチル－N－フェニルアミノ) フェニルメチル)－1, 4, 9

－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(141) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－シクロヘキシリルメチル－9－(4

10 －(N－メチル－N－フェニルアミノ) フェニルメチル)－1, 4, 9－ト
リ亞ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(142) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－(2－メチルプロピル)－9－

(2－(3, 5－ジメチルピラゾール－1－イル)－5－メトキシフェニル
メチル)－1, 4, 9－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (143) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－シクロヘキシリルメチル－9－(2
－(3, 5－ジメチルピラゾール－1－イル)－5－メトキシフェニルメチ
ル)－1, 4, 9－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(144) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－(2－メチルプロピル)－9－

(3, 5－ジエチル－1－(4－クロロフェニル) ピラゾール－4－イルメ
チル)－1, 4, 9－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(145) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－シクロヘキシリルメチル－9－(3,

5－ジエチル－1－(4－クロロフェニル) ピラゾール－4－イルメチル)

－1, 4, 9－トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(146) 1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－(2－メチルプロピル)－9－

25 (6－フェニルオキシピリジン－3－イルメチル)－1, 4, 9－トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン、

- (147) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (148) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (149) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 10 (150) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (151) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルチオフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 15 (152) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (153) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 20 (154) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 25 (155) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-

イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(156) (3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (157) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9-
(3, 5-ジメチル-1- (4-メチルフェニル) ピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(158) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,
5-ジメチル-1- (4-メチルフェニル) ピラゾール-4-イルメチル)
10 - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(159) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9-
(3, 5-ジメチル-1- (4-クロロフェニル) ピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(160) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,
15 5-ジメチル-1- (4-クロロフェニル) ピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(161) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9-
(3, 5-ジメチル-1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール
- 4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (162) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,
5-ジメチル-1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール-4-
イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(163) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9-
25 (3, 5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(164) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,

- 5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(165) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(166) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) -9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(167) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) -9-(2-(1, 4-ベンゾジオキサン-2-イル)チアゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(168) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) -9-(4-トリフルオロメチル-2-(モルホリン-1-イル)チアゾール-5-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
15 (169) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル) -9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(170) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル) -9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
20 (171) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-カルボキシフェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(172) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシリエチル) -9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

- (173) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-シクロヘキシリエチル)
 -9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (174) (3 R) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)
 -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (175) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -9-
 (4-メチル-2-フェニルチアゾール-5-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (176) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -9-
 (2- (チオフェン-1-イル) チアゾール-4-イルメチル) -1, 4,
 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (177) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -9-
 (2- (ピリジン-4-イル) チアゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9
 15 -トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (178) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,
 4-ジメトキシフェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
- (179) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9- (3,
 20 5-ジメトキシフェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
- (180) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -9-
 (5- (ピリジン-2-イル) フラン-2-イルメチル) -1, 4, 9-ト
 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (181) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -9-
 (5- (ピリジン-3-イル) フラン-2-イルメチル) -1, 4, 9-ト

- リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(182) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)フェニルメチル)-1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (183) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(5-クロロピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(184) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-ト
10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(185) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(186) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
15 ル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-
4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(187) (3R)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘ
キシリルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イ
ルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (188) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(4-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(189) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-(ピリジン-2-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザス
25 ピロ [5. 5] ウンデカン、
(190) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-

- (4-(ピリジン-3-イル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(191) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(192) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピラジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(193) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(194) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-4-イル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
15 (195) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(196) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(ナフタレン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
20 (197) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
(198) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (199) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-4-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (200) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (201) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 10 (202) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (203) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-ニトロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 15 (204) (3R)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (205) (3S)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 20 (206) (3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 25 (207) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(カルボキシメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]

ウンデカン、

(208) 1-(3-ヒドロキシブチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

5 (209) 1-(3-ヒドロキシプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(210) 1-(2-ヒドロキシブチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(211) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-アミノフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

15 (212) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(フェニルカルボニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(213) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-((4-メチルフェニル)スルホニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

20 (214) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(215) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(216) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-

- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(217) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-
9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン、
5 (218) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-
9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(219) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
10 ロ [5. 5] ウンデカン、
(220) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-
(2-ジエチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(221) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-
15 -(2-ジメチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(222) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-
プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
20 (223) 1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シク
ロヘキシリメチル-9-(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(224) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-
シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
25 ロ [5. 5] ウンデカン、
(225) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-

(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(226) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-ジメチルアミノ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(227) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-ジエチルアミノ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(228) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(229) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(230) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(5-(3-メチル-4-クロロフェニル) - 1-(4-メチルフェニルメチル)ピラゾール-3-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(231) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-ジメチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(232) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(233) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-シクロヘキシリルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (234) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (235) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (236) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4-ブチルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (237) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (2-メチルプロピル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (238) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (239) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (240) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (2-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (241) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (3-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (242) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン、

(243) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

5 (244) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(245) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.

10 5] ウンデカン、

(246) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチル-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

15 (247) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(7-メトキシ-1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(248) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

20 (249) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン、

(250) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.

25 5] ウンデカン、

(251) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ

ル) - 9 - (4-メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(252) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4 - (1-メチルエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
5 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(253) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (3-フルオロー-4-メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(254) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4 - (2-ヒドロキシエチルオキシ) フェニルメチル) - 1,
10 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(255) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (2-ヒドロキシ-3-メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (256) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4-トリフルオロメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(257) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (3-メチル-5-クロロー-1-フェニルピラゾール-4-イル
20 メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(258) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルピリジン-3-イルメチル) - 1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(259) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニル
25 メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (260) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (261) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (5 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (262) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (263) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (264) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニル - 5 - メチルオキサゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (265) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (266) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (267) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (268) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピ

ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(ピリジン-2-イル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (269) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-ヒドロキシフェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 5 (270) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (2-カルボキシエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (271) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4- (ジメチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 10 (272) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 15 (273) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (2-カルボキシ-1-エテニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (274) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (2-カルボキシ-1-エテニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 20 (275) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (4-アミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (276) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9 - (4- (4-アミノスルホニルフェニルオキシ) フェニルメチル)

- 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(277) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (3, 5 –ジメチル – 1 –ベンジルピラゾール – 4 –イルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (278) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (3, 5 –ジメチル – 1 – (2, 4 –ジフルオロフェニル) ピラゾール – 4 –イルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(279) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (4 – (ピロリジン – 1 –イルメチル) フェニルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
10 (280) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (3, 5 –ジメチル – 1 – (4 – (モルホリン – 4 –イルスルホニル) フェニル) ピラゾール – 4 –イルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (281) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (3, 5 –ジメチル – 1 – (4 – (メチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール – 4 –イルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (282) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (4 – (4 –シアノフェニルオキシ) フェニルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(283) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピル) – 9 – (4 – (ジメチルアミノメチル) フェニルメチル) – 1, 4, 9 –トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
25 (284) (3 S) – 1 –ブチル – 2, 5 –ジオキソ – 3 – (2 –メチルプロピ

- ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(2-ジメチルアミノエチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、3
- (285) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3 - (4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (286) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4 - (3-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (287) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (288) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (289) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (290) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (291) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (292) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ

ル) - 9 - (4 - (モルホリン-4-イルメチル) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(293) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (4-メチルピペラジン-1-イルメチル) フェニルメチ
5 ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、3
(294) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - フェニルスルホニルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(295) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
10 ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-シクロヘキシリピラゾール-4-イル
メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(296) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (3-カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (297) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (ピペリジン-1-イルメチル) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(298) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 - (4 - (ピロリジン-1-イルスルホ
20 ニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザス
ピロ [5. 5] ウンデカン、
(299) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
25 (300) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 - (4 - (2-ヒドロキシエチルアミノ

スルホニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (301) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(カルボキシメチルオキシ) フェニルメチル) -1, 4,
 5 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (302) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(1-フェニル-1-ヒドロキシメチル) フェニルメチル)
 -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (303) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(4-ヒドロキシペリジン-1-イルメチル) フェニル
メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (304) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ) フェニルメチル)
 -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 15 (305) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(ビス(メチルスルホニル) アミノ) フェニルメチル) -
 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (306) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルオキシ) フェニル
メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 20 (307) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(3-(3-ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) -1, 4,
 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (308) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(メチルスルホニルアミノ) フェニルメチル) -1, 4,
 25 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (309) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (6- (4-メトキシフェニルオキシ) ピリジン-3-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (310) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (311) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-クロロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 10 (312) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (3- (4-カルボキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (313) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (フェニルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 15 (314) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メチルチオフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (315) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4- (4- (2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 20 (316) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4-アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 25 (317) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピ

- ル) - 9 - (4-ジメチルアミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(318) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
5 ウンデカン、
(319) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(320) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4- (4-メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
10 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(321) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4- (4-メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(322) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (2-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
15 5] ウンデカン、
(323) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (3-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
20 5] ウンデカン、
(324) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4-フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
25 5] ウンデカン、
(325) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (3-クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
30 5] ウンデカン、
(326) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

ルー9-(4-シクロヘキシルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン、

(327) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-メトキシ-3-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-
5トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(328) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(2-クロロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、

10 (329) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(2-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、

(330) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、

15 (331) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、

20 (332) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピ
ロ[5.5]ウンデカン、

(333) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3-(2-メチルプロピル)フェニルメチル)-1,4,9-ト
リアザスピロ[5.5]ウンデカン、

25 (334) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3-ブチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、

- (335) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (336) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - メトキシ - 3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (337) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (338) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (339) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (340) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (7 - メトキシ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (341) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - メチル - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (342) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (343) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (344) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (3-メチル-5-クロロ-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 5 (345) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (2, 3-ジメチル-5-オキソ-1-フェニルピラゾリン-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (346) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (1- (2-メチルプロピルオキシカルボニル) インドール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 10 (347) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (5-メチル-2-フェニルオキサゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (348) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (3, 5-ジメチル-1- (4-メチルスルホニルアミノフェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 15 (349) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (4- (4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (350) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (4- (6-メチルピリジン-3-イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 20 (351) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9- (4- (6-メチルピリジン-1-オキシド-3-イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (352) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (353) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (6 - フェニルピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (354) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 10 (355) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (356) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - ヒドロキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 15 (357) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (2 - カルボキシエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (358) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - ヒドロキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 20 (359) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (360) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ジメチルアミノスルホニル) フ

エニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(361) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ)フ

5 エニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(362) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(2-カルボキシ-1-エチニル)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(363) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-((1E)-2-カルボキシ-1-エチニル)フェニルオキシ)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(364) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-アミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(365) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-アミノスルホニルフェニルオキシ)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(366) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-ベンジルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(367) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(2, 4-ジフルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカ

25 ン、

(368) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

- ルー9-(4-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(369) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(モルホン-4-イルスルホニル)
5 フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、
(370) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
10 (371) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)
-N-メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(372) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4
-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
15 (373) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(4-(ジメチルアミノメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-
トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
20 (374) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(3-(4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9
-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(375) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール
25 -4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(376) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

ルー 9 - (4 - (フェニルカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(377) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルアミノスルホニルフェニル)

5 ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ
ンデカン、

(378) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (1, 3, 5 - トリメチルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4,
9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

10 (379) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4,
9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(380) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (3 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
15 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(381) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル)
- 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、 3

20 (382) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (ピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチ
ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(383) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - フェニルスルホニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

25 (384) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - シクロヘキシルピラゾール - 4 - イルメ

- チル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(385) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4- (3-カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (386) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4- (ピペリジン-1-イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(387) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (3, 5-ジメチル-1- (4- (ピロリジン-1-イルスルホニ
10 ル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピ
ロ [5. 5] ウンデカン、
(388) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (389) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (4- (4-カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(390) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (3, 5-ジメチル-1- (4- (2-ヒドロキシエチルアミノス
20 ルホニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(391) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ
ル-9- (3, 5-ジメチル-1- (4- (2-ジメチルアミノエチルアミ
ノスルホニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-ト
25 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、 3
(392) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

- ルー9-(4-(1-ヒドロキシ-1-フェニルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(393) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(カルボキシメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
5 (394) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-ヒドロキシペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(395) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
10 (396) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
15 (397) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-(3-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(398) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(メチルスルホニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
20 (399) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(6-(4-メトキシフェニル)ピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
(400) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
25

- (401) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-クロロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- (402) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-ビス(メチルスルホニル)アミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- (403) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(3-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- 10 (404) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(フェニルアミノカルボニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- (405) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-メチルチオフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- 15 (406) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(4-(2-ジメチルアミノエチルアミノカルボニル)フェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- 20 (407) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-アミノカルボニルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- (408) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチル-9-(4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン,
- 25 (409) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリメチ

ルー 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(410) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4,
5 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(411) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピリデン) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(412) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシエチル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4,
10 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(413) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-エチリデン-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
15 (414) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピリデン) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(415) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9-ベンジルオキシカルボニル-1,
20 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(416) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
(417) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメ
チル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (418) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニ
ルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
- 5 (419) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルオキシピリジン -
3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (420) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキ
シ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (421) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - シクロヘキシルオキシフェ
ニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (422) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4
- イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
- 15 (423) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (ピリジン - 3 - イルオキ
シ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (424) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチ
ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (425) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 -
メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザス

ピロ [5. 5] ウンデカン、

(426) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 -
フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.

5 5] ウンデカン、

(427) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - カルボキシフェニル
オキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
カン、

10 (428) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (ピリ
ジン - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (429) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 -
カルボキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (430) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - ベンジルオキシカルボニル
- 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(431) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、

25 (432) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェ
ニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (433) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 -
フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- 5 (434) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニ
ルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (435) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジ
10 ン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (436) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 -
(4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - ト
15 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (437) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (4 - (4 - メトキシフェ
ニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ
ンデカン、
- 20 (438) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (4 - (4 - フルオロフェ
ニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ
ンデカン、
- (439) (3 R*) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 -
25 ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリメチル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホ
ニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピ

口 [5. 5] ウンデカン、

(440) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-アリルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (441) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(442) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(443) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(444) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-(4-イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(445) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-(4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(446) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (447) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシリメチル) - 9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 5 (448) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (449) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (3, 5-ジメチル-1- (4-メチルフェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 10 (450) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (4-(4-メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
- 15 ウンデカン,
- (451) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 20 (452) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (4-イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- (453) (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン,
- 25 (454) (3 R*) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*) - 1-

ヒドロキシー-1-シクロヘキシリメチル) -9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (455) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-ヒドロキシー-1-シクロヘキシリメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (456) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-ヒドロキシー-1-シクロヘキシリメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (457) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-ヒドロキシー-1-シクロヘキシリメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (458) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-ヒドロキシー-1-シクロヘキシリメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (459) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (460) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (461) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (462) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒ

- ドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
 (463) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (464) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 10 (465) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (466) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(4-フェニルオキシフェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 15 (467) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 20 (468) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 R)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (469) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒドロキシー-2-メチルプロピル) -1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

- (470) (3 R) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 S) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (471) (3 R) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 S) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (472) (3 R) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 S) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (473) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 R) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (474) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 R) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (475) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 R) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (476) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- ((1 R) - 1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 9- (4- (4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (477) (3 S) - 2, 5-ジオキソ-3- (3-ベンジルオキシカルボニル

アミノプロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(478) (3S) - 1-メチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9

5 -トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、または

(479) (3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシリルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル) - 9 -オキシド-1, 4, 9 -トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性

10 塩である請求の範囲 1 記載の化合物。

7. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有する医薬組成物。

15

8. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有するケモカイン／ケモカイン受容体作用の制御剤。

20

9. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有する喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー性気管支肺アスペルギルス症、アレルギー性好酸球性胃腸症、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ、乾癬、鼻炎、結膜炎、虚血再灌流傷害の抑制、多発性硬化症、潰瘍性大腸炎、急性呼吸窮迫

症候群、細菌感染に伴うショック、糖尿病、自己免疫疾患の治療、移植臓器拒絶反応、免疫抑制、癌転移予防、後天性免疫不全症候群の予防および／または治療剤。

配列表

SEQUENCE LISTING

<110> ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.

<120> Triazaspiro [5.5] undecane derivatives and medicament containing the derivative as active ingredient

<130> ONF-3569PCT

<150> JP 11-344967

<151> 1999-12-03

<150> JP 2000-18673

<151> 2000-01-27

<150> JP 2000-27968

<151> 2000-02-04

<150> JP 2000-147882

<151> 2000-05-19

<160> 2

<170> PatentIn Ver. 2.1

<210> 1

<211> 37

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Description of Artificial Sequence: Forward primer
hCCR5XbaI

<400> 1

agcttagtcta gatccgttcc cctacaagaa actctcc

37

<210> 2

<211> 37

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Description of Artificial Sequence:Revese primer

hCCR5XbaI

<400> 2

agcttagtcta gagtgacacaa ctctgacagg gtcacca

37

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08517

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 98/25605, A1 (MERCK & CO., INC.), 18 June, 1998 (18.06.98), Cited in the present application; Claims & US, 5962462, A	1-9
A	WO, 97/11940, A1 (ELI LILY AND COMPANY), 03 April, 1997 (03.04.97), Cited in the present application; Claims & CA, 2233204, A & EP, 854869, A & NZ, 320963, A & JP, 11-512723, A	1-9
A	EP, 268868, A2 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 01 June, 1988 (01.06.88), Full text & BE, 897843, A1 & GB, 2127807, A1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CS, 231227 B1	1-9
A	GB, 2127807, A1 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 18 April, 1984 (18.04.84),	1-9

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 February, 2001 (14.02.01)

Date of mailing of the international search report
27 February, 2001 (27.02.01)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08517

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>Full text & BE, 897843, A1 & CS, 231227, B1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CH, 655929, A & FR, 2533919, A1 & JP, 59-89671, A2 & DE, 3335891, A1</p> <p>Blazickova, S. et al., 'Immunomodulatory characteristics of synthetic cyclic dipeptides' Int. J. Immunother. (1994), Vol.10, No.3, pp.89-93, Discussion</p>	1-9

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int.C1' C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int.C1' C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS(STN), CAOLD(STN), REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO, 98/25605, A1 (MERCK & CO., INC.), 18.6月.1998 (18.06.98), 本願で引用, 請求の範囲参照 & US, 5962462, A	1-9
A	WO, 97/11940, A1 (ELI LILY AND COMPANY), 3.4月.1997 (03.04.97), 本願で引用, 請求の範囲参照 & CA, 2233204, A & EP, 854869, A & NZ, 320963, A & JP, 11-512723, A	1-9

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

14. 02. 01

国際調査報告の発送日

27.02.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

新留 豊



4C 9639

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	EP, 268868, A2 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 1.6月.1988 (01.06.88), 全文参照 & BE, 897843, A1 & GB, 2127807, A1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CS, 231227 B1	1-9
A	GB, 2127807, A1 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 18.4月.1984 (18.04.84), 全文参照 & BE, 897843, A1 & CS, 231227, B1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CH, 655929, A & FR, 2533919, A1 & JP, 59-89671, A2 & DE, 3335891, A1	1-9
A	Blazickova, S., et al., 'Immunomodulatory characteristics of synthetic cyclic dipeptides' Int. J. Immunother. (1994), Vol. 10, No. 3, p. 89-93, Discussion 参照	1-9